

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 07-017952

(43)Date of publication of application : 20.01.1995

(51)Int.Cl.

C07D233/70
A61K 31/415
A61K 31/42
A61K 31/425
C07D263/38
C07D277/34
C07D401/12
C07D403/12
C07D409/12
C07D417/12
C07D417/12

(21)Application number : 05-159195

(71)Applicant : NISSAN CHEM IND LTD

(22)Date of filing : 29.06.1993

(72)Inventor : TANIGAWA KEIZO
SAITO AKIRA
HIROTSUKA SANKO
SHIKADA KENICHI

(54) BENZYLIDENE DERIVATIVE

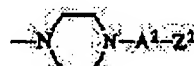
(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain the novel substance composed of a specified benzylidene compound derivative, having a strong bronchodilator effect and useful for, e.g. prevention and therapy of chronic reversible obstructive respiratory diseases such as bronchial asthma, bronchitis and adult respiratory distress syndrome.

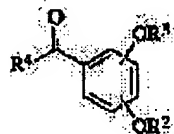
CONSTITUTION: A compound (e.g. diethyl-2,4-dioxoimidazolidine-5-phosphonate) represented by formula I [R is H, a 1 to 10C alkyl, a (substituted) phenyl, formula II (A2 is, e.g. a 1 to 10C alkylene which may contain O; Z2 is a phenyl which may be substituted), etc.; X is O, S, amino, etc.; W is H or phosphonate] is reacted with a benzoyl derivative (e.g. 3-cyclopentyloxy-4-methoxybenzaldehyde) expressed by formula III [R2 is H or a 1 to 4C alkyl; R3 is a (substituted) cycloalkyl, a (substituted) phenyl, etc.; R4 is H or a 1 to 4C alkyl] or its salt in the presence of a base. The objective benzylidene derivative represented by formula IV and having a strong bronchodilator effect can be obtained thereby.



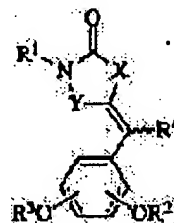
I



II



III



IV

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than
the examiner's decision of rejection or
application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision
of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2000 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平7-17952

(43) 公開日 平成 7 年 (1995) 1 月 20 日

(51) Int. Cl. °	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C07D233/70				
A61K 31/415	ACF	9454-4C		
31/42	ACE	9454-4C		
31/425	ACD	9454-4C		
C07D263/38				

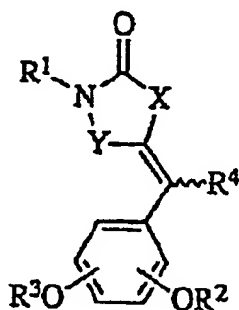
審査請求 未請求 請求項の数 9 O L (全67頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平5-159195	(71) 出願人	000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(22) 出願日	平成5年(1993)6月29日	(72) 発明者	谷川 啓造 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学 工業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	斎藤 晃 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学 工業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	廣塚 三晃 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学 工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ベンジリデン誘導体

(57) 【要約】 (修正有) 【構成】



により表される化合物又はその塩及びその製法並びにこれらを有効成分として含有することを特徴とする医薬組成物。

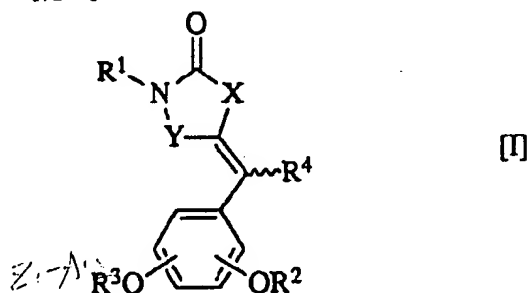
【効果】 これらの化合物は強い気管支拡張作用を有し、

気管支喘息、気管支炎及び成人呼吸窮迫症候群等の慢性可逆閉塞性呼吸疾患の有用な予防及び治療薬として有用である。

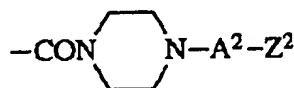
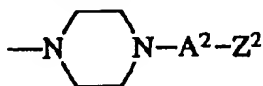
【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式〔I〕

【化1】

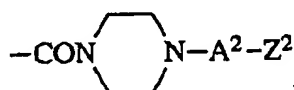
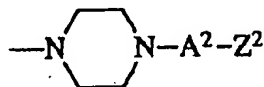


〔式中、R¹は水素原子、炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～7のシクロアルキル基、A¹-Z¹〔A¹は水酸基、炭素数1～4の直鎖のアルキル基で



(A¹は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z¹はフェニル基〔該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。〕、カルボキシル基、又はCO₂R⁵〔R⁵は前記に同じ。〕を示す。〕を示す。R⁵は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。R⁵は任意の位置に水酸基で置換されてもよい炭素数3～7のシクロアルキル基、又はA¹-Z¹〔A¹、Z¹は前記に同じ。〕を示す。R⁵は水素原子、炭素数1～4の直鎖のアルキル基を示す。Xは酸素原子、硫黄原子、NR⁶〔R⁶は水素原子、炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～7のシクロアルキル基、A¹-Z¹〔A¹、Z¹は前記に同じ。〕を示す。〕を示す。Yは-CH₂-、又は-CO-を示す。〕で表されるベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩。

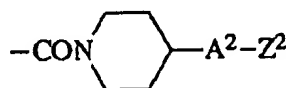
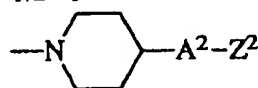
【請求項2】 R¹が炭素数1～4までのアルキル基である



(A¹は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z¹はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコ

置換されてもよく任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10のアルキレンを、Z¹はフェニル基〔該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。〕、いずれの位置で置換してもよいチエニル基、ピリジル基、CO₂R⁵〔R⁵は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。〕、NR⁶R⁷〔R⁶及びR⁷はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R⁶及びR⁷が一緒になって炭素数2～6の環状アルキレンを形成する。〕、CONR⁶R⁷〔R⁶、R⁷は前記に同じ。〕、

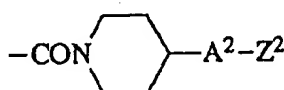
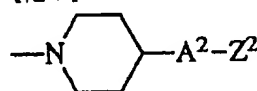
【化2】



請求項1記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

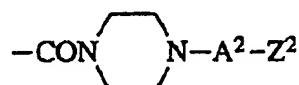
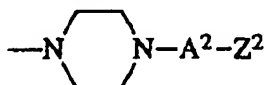
【請求項3】 R¹が任意の位置に水酸基で置換されてもよい炭素数3～7のシクロアルキル基、又はA¹-Z¹〔A¹は水酸基、炭素数1～4の直鎖のアルキル基で置換されてもよく任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10のアルキレンを、Z¹はフェニル基〔該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。〕、CO₂R⁵〔R⁵は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。〕、NR⁶R⁷〔R⁶及びR⁷はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R⁶及びR⁷が一緒になって炭素数2～6の環状アルキレンを形成する。〕、CONR⁶R⁷〔R⁶、R⁷は前記に同じ。〕、

【化3】



キシ基で置換されてもよいフェニル基、カルボキシル基、又はCO₂R⁵〔R⁵は前記に同じ。〕を示す。〕で表される請求項2記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

【請求項4】R'が水素原子、炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～7のシクロアルキル基、A'-Z' (A'は水酸基、炭素数1～4の直鎖のアルキル基で置換されてもよく任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10のアルキレンを、Z'はフェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよ



(A'は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z'はフェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。)、カルボキシル基、又はCO₂R' (R'は前記に同じ。))を示す。}で表される請求項3記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

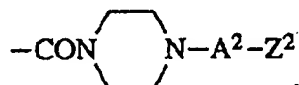
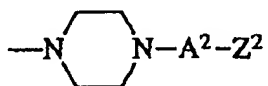
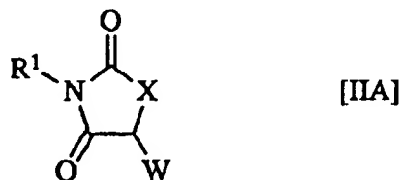
【請求項5】XがNR'である請求項4記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

【請求項6】Yが-CO-である請求項5記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

【請求項7】R'が水素原子である請求項6記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得る塩。

【請求項8】一般式 (IIA)

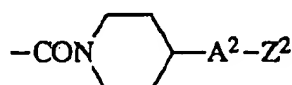
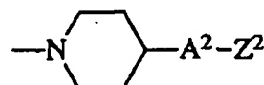
【化5】



(A'は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z'はフェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。)、カルボキシル基、又はCO₂R' (R'は前記に同じ。))

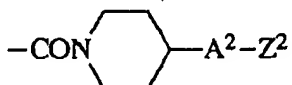
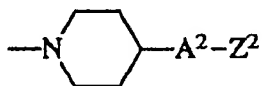
い。)、いずれの位置で置換してもよいシリル基、NR' (R' (R'及びR'はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R'及びR'が一緒になって炭素数2～6の環状アルキレンを形成する。)、CONR' R' (R'、R'は前記に同じ。))、

【化4】



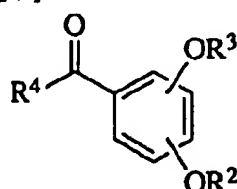
【式中、R'は水素原子、炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～7のシクロアルキル基、A'-Z' (A'は水酸基、炭素数1～4の直鎖のアルキル基で置換されてもよく任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10のアルキレンを、Z'はフェニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。)、いずれの位置で置換してもよいチエニル基、シリル基、CO₂R' (R'は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。)、NR' R' (R'及びR'はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R'及びR'が一緒になって炭素数2～6の環状アルキレンを形成する。)、CONR' R' (R'、R'は前記に同じ。))、

【化6】



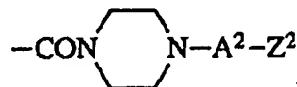
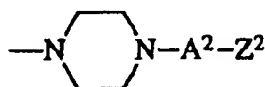
を示す。)}を示す。Xは酸素原子、硫黄原子、NR' (R'は水素原子、炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～7のシクロアルキル基、A'-Z' (A'、Z'は前記に同じ。))を示す。Wは水素原子、又はホスホナート基を示す。)}で表される化合物と一般式 (III)

【化7】



【III】

【式中、R¹は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。R²は任意の位置に水酸基で置換されてもよい炭素数3～7のシクロアルキル基、A¹-Z¹〔A¹は水酸基、炭素数1～4の直鎖のアルキル基で置換されてもよく任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10のアルキレンを、Z¹はフェ



(A¹は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1～10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z¹はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよいフェニル基、カルボキシル基、又はCO₂R⁵ (R⁵は前記に同じ。)を示す。) R⁴は、水素原子、炭素数1～4の直鎖のアルキル基を示す。)を示す。〕で表されるベンジリデン誘導体又はその塩を塩基の存在下反応させることを特徴とする請求項1記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩の製造法。

【請求項9】請求項1の記載のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩を有効成分とする気管支拡張薬。

【発明の詳細な説明】

【0001】

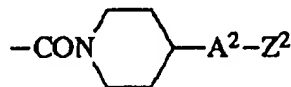
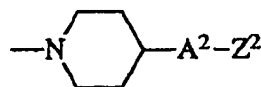
【産業上の利用分野】本発明は、気管支拡張作用を有する新規なベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容される塩、その製造法並びにこれらを有効成分として含有する医薬組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】気管支喘息、気管支炎及び成人呼吸窮迫症候群 (Adult Respiratory Distress Syndrome) 等の慢性可逆閉塞性呼吸疾患の治療においては発作時の気道緩解が重要で有り、かかる目的のために気管支拡張剤が使用されている。現在臨床使用されている主要な気管支拡張剤はサルブタモールをはじめとしたβ-刺激薬とテオフィリンに代表されるキサンチン系薬剤とに大別される。前者においては、難治化に伴いその効力が減弱するという難点があり、さらに気管支喘息治療においては頻回長期投与による症状の悪化も危惧議論されている (Th

ニル基 (該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい)、いずれの位置で置換してもよいチエニル基、ピリジル基、CO₂R⁶ (R⁶は水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。)、NR⁶R⁷ (R⁶及びR⁷はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3～8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R⁶及びR⁷が一緒になって炭素数2～6の環状アルキレンを形成する。)、CONR⁶R⁷ (R⁶、R⁷は前記に同じ。)、

【化8】



20 e New England Journal of Medicine, 321, 1517-1527, 1989).

【0003】一方、テオフィリン系薬剤においては、安全域が狭く使用面の制約を伴っているのが現状である。上記疾患においては、気道の閉塞を主訴とするものであるが、その病態は気道の炎症である。従って気道の炎症を治療する薬剤が望まれている。現在この面での治療薬は、主にステロイドにとどまっており、副作用という大きな問題をかかえている。最近、ホスホジエステラーゼ (PDE) IV阻害剤であるロリプラムは、テオフィリンの副作用として危惧されている循環器系の作用が弱く、気管支拡張作用を持ち、さらに好産球、好中球等の炎症細胞の機能を抑制する作用を持つ事が報告されている [Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 344, 682-690, (1991), Br. J. Pharmacol., 99, 679-686, 1990].

【0004】現在、このような作用をあわせ持つ薬剤は、今だ開発されておらず、新しい抗喘息剤として大いに期待されるものである。本発明の一般式〔1〕のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩と公知文献に記載された化合物との関係を以下に説明する。

a) アメリカ特許5036079号公報にはベンジリデン基の置換基R¹、R²において、アルコキシ基、水酸基であるベンジリデン誘導体の記載が有る。医薬的用途としては、5-リボキシゲナーゼ、シクロオキシゲナーゼ阻害剤であるが本発明化合物に該当する実施例はなく化合物の例示についての記載もない。

b) 日本公開特許公報、特開平262864号公報にはベンジリデン基の置換基R¹、R²において、アルコキシ基、水酸基であるベンジリデン誘導体の記載が有る。医薬的用途としてはアレルギー又は炎症治療薬であるが、本発明化

合物に該当する実施例はなく化合物の例示についての記載もない。

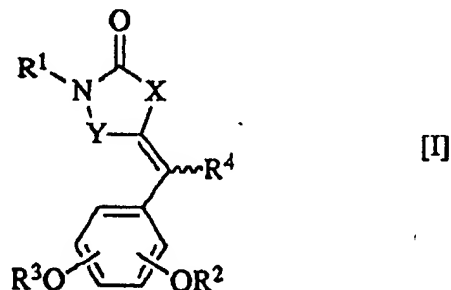
【0005】

【課題を解決するための手段】本発明者等は気管支拡張作用を有し、さらに抗炎症作用を持つ化合物の探索に鋭意研究を行なった結果、本発明のベンジリデン誘導体および薬学的に許容し得る塩が、強い気管支拡張作用を有しさらに抗炎症作用が大いに期待される化合物である事を見だし、本発明を完成した。

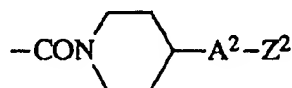
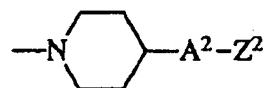
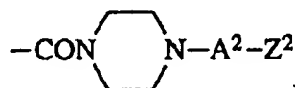
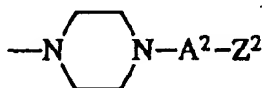
【0006】即ち、本発明は一般式【I】

【0007】

【化9】



【I】



【0010】(A'は任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1~10の直鎖又は分枝鎖のアルキレンを、Z'はフェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。)、カルボキシル基、又はCO₂R¹(R¹は前記に同じ。))を示す。))を示す。))を示す。

【0011】R¹は水素原子、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。R²は任意の位置に水酸基で置換されてもよい炭素数3~7のシクロアルキル基、又はA'-Z' (A', Z'は前記に同じ。))を示す。R³は水素原子、炭素数1~4の直鎖のアルキル基を示す。Xは酸素原子、硫黄原子、NR⁴ (R⁴は水素原子、炭素数1~10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3~7のシクロアルキル基、A'-Z' (A', Z'は前記に同じ。))を示す。))を示す。Yは-CH₂-、又は-CO-を示す。))で表されるベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩、その製造法並びにこれらを有効成分として含有する医薬組成物に関するものである。

【0012】以下、上記一般式【I】の本発明化合物におけるR¹、R²、R³、R⁴、X及びYについて具体的に挙げ、本発明化合物について詳説する。

【0013】R¹としては、水素原子、メチル基、エチル

10

【0008】〔式中、R¹は水素原子、炭素数1~10の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3~7のシクロアルキル基、A'-Z' (A'は水酸基、炭素数1~4の直鎖のアルキル基で置換されてもよい任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1~10のアルキレンを、Z'はフェニル基(該フェニル基はハロゲン原子、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基で置換されてもよい。))、いずれの位置で置換してもよいチエニル基、ピリジル基、CO₂R¹ (R¹は水素原子、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基を示す。))、NR⁴R¹ (R⁴及びR¹はそれぞれ同一又は異なり水素原子、炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖のアルキル基、炭素数3~8の環状アルキル基、フェニル基を示すか、R⁴及びR¹が一緒になって炭素数2~6の環状アルキレンを形成する。))、CONR⁴R¹ (R⁴、R¹は前記に同じ。))、

【0009】

【化10】

30

40

基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、i-ペンチル基、sec-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-ヘキシル基、sec-ヘキシル基、n-ヘプチル基、i-ヘプチル基、n-オクチル基、i-オクチル基、n-ノニル基、i-ノニル基、n-デカニル基、i-デカニル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基等を挙げられる。好ましくは、水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基が挙げられる。又R¹としてA'-Z'が挙げられる。〔ここで、A'は水酸基、炭素数1~4の直鎖のアルキル基で置換されてもよい任意の位置にエーテル結合として酸素原子を含んでもよい炭素数1~10のアルキレンを示す。Z'はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、i-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等で置換されたフェニル基、無置換のフェニル基、カルボキシル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、

50

i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-チエニル基、3-チエニル基、カルバモイル基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-n-プロピルアミノ基、N-i-プロピルアミノ基、N-n-ブチルアミノ基、N-i-ブチルアミノ基、N-sec-ブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N、N-ジメチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、N、N-ジ-n-プロピルアミノ基、N、N-ジ-i-プロピルアミノ基、N、N-ジ-n-ブチルアミノ基、N、N-ジ-i-ブチルアミノ基、N、N-ジ-sec-ブチルアミノ基、N、N-ジ-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロブチルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-シクロヘブチルアミノ基、N-シクロオクチルアミノ基、N、N-ジシクロプロピルアミノ基、N、N-ジシクロペンチルアミノ基、N、N-ジシクロヘキシルアミノ基、N-メチル-N-シクロペンチルアミノ基、N-エチル-N-シクロペンチルアミノ基、N-n-プロピル-N-シクロプロピルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-メチル-N-フェニルアミノ基、N-エチル-N-フェニルアミノ基、N-n-プロピル-N-フェニルアミノ基、N-シクロプロピル-N-フェニルアミノ基、N-シクロペンチル-N-フェニルアミノ基、1-アジリジノ基、1-アジチジノ基、1-ピロリジノ基、1-ピベリジノ基、N-メチルアミノカルボニル基、N-エチルアミノカルボニル基、N-n-プロピルアミノカルボニル基、N-i-プロピルアミノカルボニル基、N-n-ブチルアミノカルボニル基、N-i-ブチルアミノカルボニル基、N-sec-ブチルアミノカルボニル基、N-t-ブチルアミノカルボニル基、N、N-ジメチルアミノカルボニル基、N、N-ジエチルアミノカルボニル基、N、N-ジ-n-プロピルアミノカルボニル基、N、N-ジ-i-プロピルアミノカルボニル基、N、N-ジ-n-ブチルアミノカルボニル基、N、N-ジ-i-ブチルアミノカルボニル基、N、N-ジ-sec-ブチルアミノカルボニル基、N、N-ジ-t-ブチルアミノカルボニル基、N-シクロプロピルアミノカルボニル基、N-シクロブチルアミノカルボニル基、N-シクロペンチルアミノカルボニル基、N-シクロヘキシルアミノカルボニル基、N-シクロヘブチルアミノカルボニル基、N、N-ジシクロプロピルアミノカルボニル基、N、N-ジシクロブチルアミノカルボニル基、N、N-ジシクロペンチルアミノカルボニル基、N-メチル-N-シクロプロピルアミノカルボニル基、N-エチル-N-シクロプロピルアミノカルボニル基、N-メチル-N-シクロペンチルアミノカルボニル基、N-エ

チル-N-シクロペンチルアミノカルボニル基、N-n-プロピル-N-シクロプロピルアミノカルボニル基、N-n-プロピル-N-シクロペンチルアミノカルボニル基、N-メチル-N-シクロペンチルアミノカルボニル基、N-フェニルアミノカルボニル基、N-メチル-N-フェニルアミノカルボニル基、N-エチル-N-フェニルアミノカルボニル基、N-n-プロピル-N-フェニルアミノカルボニル基、N-シクロプロピル-N-フェニルアミノカルボニル基、N-シクロペンチル-N-フェニルアミノカルボニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペラジニル基又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、i-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペラジニル基又は1-(4-メチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-エチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-n-プロピルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-i-プロピルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-n-ブチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-i-ブチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-sec-ブチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-t-ブチルカルボキシル)ピペラジニル基、1-(4-メトキシカルボニルメチル)ピペラジニル基、1-(4-エトキシカルボニルメチル)ピペラジニル基、1-(4-エトキシカルボニルエチル)ピペラジニル基、1-(4-メトキシカルボニルプロピル)ピペラジニル基、1-(4-エトキシカルボニルプロピル)ピペラジニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペリジニル基、又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、i-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペリジニル基又は1-(4-メチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-エチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-n-プロピルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-i-プロピルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-n-ブチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-i-ブチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-sec-ブチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-t-ブチルカルボキシル)ピペリジニル基、1-(4-メトキシカルボニルメチル)ピ

ビペリジニル基、1-(4-エトキシカルボニルメチル) 10
 ビペリジニル基、1-(4-エトキシカルボニルメチル) 10
 ビペリジニル基、1-(4-エトキシカルボニルエチル) 10
 ビペリジニル基、1-(4-メトキシカルボニルプロピル) 10
 ビペリジニル基、1-(4-エトキシカルボニルプロピル) 10
 ビペリジニル基、1-(4-フェニルメチル) 10
 ビペラジニルカルボニル又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、i-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル) 10
 ビペラジニルカルボニル基又は1-(4-メチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-n-プロピルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-i-プロピルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-n-ブチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-i-ブチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-sec-ブチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-t-ブチルカルボキシル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-メトキシカルボニルメチル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エトキシカルボニルメチル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エトキシカルボニルメチル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エトキシカルボニルエチル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-メトキシカルボニルプロピル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エトキシカルボニルプロピル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-エトキシカルボニルプロピル) 10
 ビペラジニルカルボニル基、1-(4-フェニルメチル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、i-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル) 10
 ビペリジニルカルボニル基又は1-(4-メチルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-エチルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-n-プロピルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-i-プロピルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-n-ブチルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-i-ブチルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-sec-ブチルカルボキシル) 10
 ビペリジニルカルボニル基、1-(4-t-ブチルカルボキシル) 10

ル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-メトキシカルボニルメチル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-エトキシカルボニルメチル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-エトキシカルボニルメチル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-エトキシカルボニルエチル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-メトキシカルボニルプロピル) ビペリジニルカルボニル基、 1- (4-エトキシカルボニルプロピル) ビペリジニルカルボニル基等を挙げることができる。}

【0014】上記置換基 Z' として好ましくは、メチル基、エチル基、 n -プロピル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等で置換されたフェニル基、無置換のフェニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、 N 、 N -ジメチルアミノ基、 N 、 N -ジエチルアミノ基、 N 、 N -ジシクロプロピルアミノ基、 N 、 N -ジシクロペンチルアミノ基、 N -メチル- N -シクロペンチルアミノ基、 N -エチル- N -シクロペンチルアミノ基、 N -メチル- N -フェニルアミノ基、 N 、 N -ジメチルアミノカルボニル基、 N 、 N -ジエチルアミノカルボニル基、 N 、 N -ジ- n -プロピルアミノカルボニル基、 N 、 N -ジシクロプロピルアミノカルボニル基、 N 、 N -ジシクロペンチルアミノカルボニル基、 N 、 N -ジシクロヘキシルアミノカルボニル基、 N -メチル- N -シクロプロピルアミノカルボニル基、 N -エチル- N -シクロプロピルアミノカルボニル基、 N -メチル- N -シクロペンチルアミノカルボニル基、 N -エチル- N -シクロペンチルアミノカルボニル基、 N -フェニルアミノカルボニル基、 N -メチル- N -フェニルアミノカルボニル基、 N -エチル- N -フェニルアミノカルボニル基、 N - n -プロピル- N -フェニルアミノカルボニル基、 N -シクロプロピル- N -フェニルアミノカルボニル基、 N -シクロペンチル- N -フェニルアミノカルボニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペラジニル又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペラジニル基又は1-(4-メチルカルボキシ)ピペラジニル基、1-(4-エチルカルボキシ)ピペラジニル基、1-(4- n -プロピルカルボキシ)ピペラジニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペリジニル基、又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、 n -プロピル基、 i -プロピル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペリジニル基又は1-(4-メチルカルボキシ)ピペリジニル基、1-(4-エチルカルボキシ)ピペリジニル基、1-(4- n -プロピルカルボキシ)ピペリジニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペラジニルカルボニル又はベンゼン環上のオルト

位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペラジニルカルボニル基又は1-(4-メチルカルボキシル)ピペラジニルカルボニル基、1-(4-エチルカルボキシル)ピペラジニルカルボニル基、1-(4-*n*-プロピルカルボキシル)ピペラジニルカルボニル基、1-(4-フェニルメチル)ピペラジニルカルボニル基、又はベンゼン環上のオルト位、メタ位、パラ位がメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子等で置換されていてもよい1-(4-置換フェニルメチル)ピペリジニルカルボニル基又は1-(4-メチルカルボキシル)ピペリジニルカルボニル基、1-(4-エチルカルボキシル)ピペリジニルカルボニル基、1-(4-*n*-プロピルカルボキシル)ピペリジニルカルボニル基等を挙げることができる。

【0015】 R^1 の具体例としては、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*i*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*sec*-ブチル基が挙げられ、さらに好ましくはメチル基が挙げられる。

【0016】 R^2 の具体例としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、1-(2-ヒドロキシ)シクロプロピル基、1-(2-ヒドロキシ)シクロブチル基、1-(3-ヒドロキシ)シクロブチル基、1-(2-ヒドロキシ)シクロペンチル基、1-(3-ヒドロキシ)シクロペンチル基、1-(2,3-ジヒドロキシ)シクロペンチル基、1-(2-ヒドロキシ)シクロヘキシル基、1-(3-ヒドロキシ)シクロヘキシル基、1-(2,3-ジヒドロキシ)シクロヘキシル基、1-(2,4-ジヒドロキシ)シクロヘキシル基、又は R^1 と同じ A^1-Z^1 を挙げることができる。好ましくは、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基及び R^1 と同じ A^1-Z^1 を挙げることができる。

【0017】 R^2 の具体例としては、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*i*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*t*-ブチル

基等が挙げられる。好ましくは、水素原子、メチル基が挙げられる。

【0018】 X の具体例としては、酸素原子、硫黄原子、モノ置換窒素原子(NR^3)が挙げられ、その置換基 R^3 としては、 R^1 と同じ置換基が挙げられる。好ましくはモノ置換窒素原子(NR^3)が挙げられる。

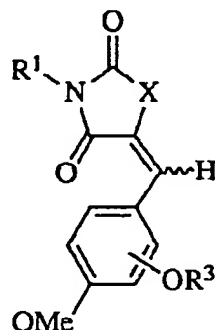
【0019】 Y は、メチレン基又はカルボニル基が挙げられ、好ましくはカルボニル基を挙げることができる。

【0020】尚、上記説明において n はノルマル、 i はイソ、*sec*はセカンダリー、*t*はターシャリーを意味する。

【0021】一般式〔I〕の本発明化合物における好ましい化合物としては、

【0022】

〔化11〕



【0023】〔式中、 R^1 、 R^2 及び X は前記と同じ。〕で表される化合物を挙げることができる。一般式〔I〕の本発明化合物には、1~9個の不斉炭素原子に基づく光学活性体ないし立体異性体が包含される。以下本発明化合物である一般式〔I〕で表されるベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容しうるその塩に包含される代表的化合物を表Iに例示するが、本発明はこれによって何ら限定されるものではない。

【0024】尚、表中の n はノルマル、 i はイソ、*sec*はセカンダリー、*t*はターシャリー、Meはメチル基、Etはエチル基、Prはプロピル基、Buはブチル基、Hexはヘキシル基、Hepはヘプチル基、Octはオクチル基、Acはアセチル基、Phはフェニル基を意味する。又、表I中のQ1~Q32は次の式で表される基である。

【0025】

〔化12〕

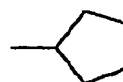
15

16

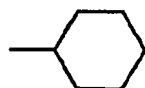
Q1



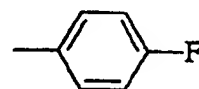
Q2



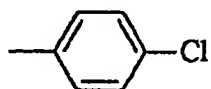
Q3



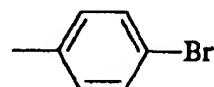
Q4



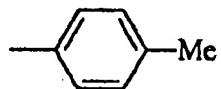
Q5



Q6



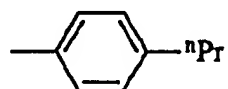
Q7



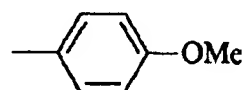
Q8



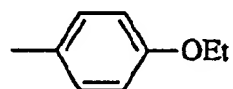
Q9



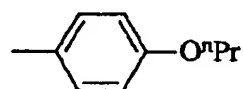
Q10



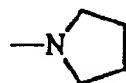
Q11



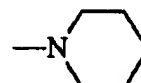
Q12



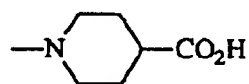
Q13



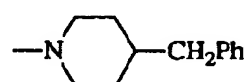
Q14



Q15



Q16



[0026]

[化13]

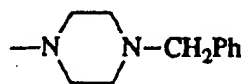
17

18

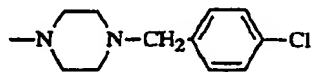
Q17



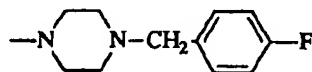
Q18



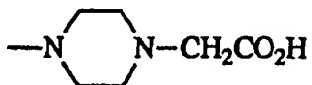
Q19



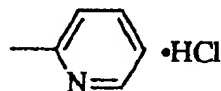
Q20



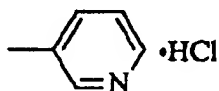
Q21



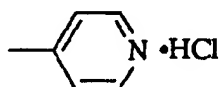
Q22



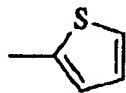
Q23



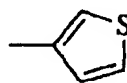
Q24



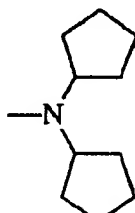
Q25



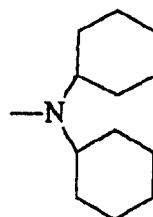
Q26



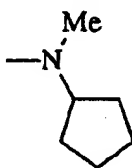
Q27



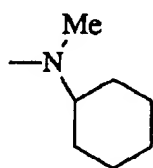
Q28



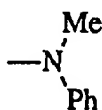
Q29



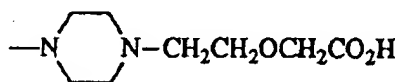
Q30



Q31



Q32



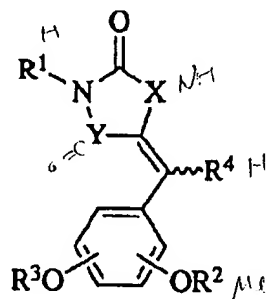
【0027】表 I

【0028】

【化14】

【0029】

【表1】



[I]

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1	H	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

19				20			
2	H	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
3	Me	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
4	Me	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
5	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	E
6	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	Z
7	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NMe	-CO-	E
8	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NMe	-CO-	Z
9	H	Me	CH ₂ COQ18·2HCl	H	NH	-CO-	E
10	H	Me	CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
11	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·HCl	H	NH	-CO-	E
12	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	Z
13	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	E
14	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	Z
15	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NMe	-CO-	E
16	H	Me	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	H	NMe	-CO-	Z
17	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
18	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
19	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	Z
20	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	E
21	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	Z
22	H	Me	(CH ₂) ₃ Ph	H	NH	-CO-	E
23	H	Me	(CH ₂) ₃ N(Et) ₂ ·HCl	H	NH	-CO-	E

【0030】

【表 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
24	H	Me	(CH ₂) ₃ N(Et) ₂ ·HCl	H	NH	-CO-	Z
25	H	Me	(CH ₂) ₃ CONEt ₂	H	NH	-CO-	E
26	H	Me	(CH ₂) ₃ CONEt ₂	H	NH	-CO-	Z
27	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
28	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
29	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Na	H	NH	-CO-	E
30	H	Me	(CH ₂) ₃ CO ₂ Na	H	NH	-CO-	Z
31	H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
32	H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
33	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
34	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
35	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
36	CH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
37	(CH ₂) ₃ CO ₂ H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
38	CH ₂ CON(Et) ₂	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
39	(CH ₂) ₃ CONEt ₂	Me	Q2	H	NMe	-CO-	E
40	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
41	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
42	(CH ₂) ₃ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
43	CH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
44	CH ₂ CONEt ₂	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
45	(CH ₂) ₃ CONEt ₂	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z

【0031】

【表3】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
46	(CH ₂) ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NMe	-CO-	Z
47	H	Me	Q1	H	NH	-CO-	E
48	H	Me	Q1	H	NH	-CO-	Z
49	H	Me	Q3	H	NH	-CO-	E
50	H	Me	Q3	H	NH	-CO-	Z
51	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
52	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
53	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
54	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
55	H	Me	CH(CH ₂)(CH ₂) ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
56	H	Me	CH(CH ₂)(CH ₂) ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
57	H	Me	CH ₂ CH(CH ₂)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
58	H	Me	CH ₂ CH(CH ₂)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
59	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₂)Ph	H	NH	-CO-	E
60	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₂)Ph	H	NH	-CO-	Z
61	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
62	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
63	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
64	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
65	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
66	H	Me	(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
67	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	E

【0032】

30 【表4】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
68	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
69	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
70	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
71	H	Me	CH(CH ₂)(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
72	H	Me	CH(CH ₂)(CH ₂) ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
73	H	Me	CH ₂ CH(CH ₂)CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	E
74	H	Me	CH ₂ CH(CH ₂)CH ₂ Q4	H	NH	-CO-	Z
75	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₂)Q4	H	NH	-CO-	E
76	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₂)Q4	H	NH	-CO-	Z
77	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	E
78	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
79	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	E
80	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
81	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	E
82	H	Me	(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
83	H	Me	CH(CH ₂)CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	E

23

24

84	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
85	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	E
86	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
87	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	E
88	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
89	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	E

【0033】

【表5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
90	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q5	H	NH	-CO-	Z
91	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q5	H	NH	-CO-	E
92	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q5	H	NH	-CO-	Z
93	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
94	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
95	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
96	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
97	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
98	H	Me	(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
99	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
100	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
101	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
102	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
103	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
104	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
105	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	E
106	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CO-	Z
107	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q7	H	NH	-CO-	E
108	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q7	H	NH	-CO-	Z
109	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	E
110	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
111	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	E

【0034】

【表6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
112	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
113	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	E
114	H	Me	(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
115	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	E
116	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
117	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	E
118	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
119	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	E
120	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
121	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	E

25

26

122	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃) CH ₂ Q10	H	NH	-CO-	Z
123	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q10	H	NH	-CO-	E
124	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q10	H	NH	-CO-	Z
125	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	E
126	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	Z
127	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	E
128	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	Z
129	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	E
130	H	Me	(CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	Z
131	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	E
132	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	Z
133	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	E

【0035】

【表7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
134	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	Z
135	H	Me	CH(CH ₃) (CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	E
136	H	Me	CH(CH ₃) (CH ₂) ₄ Q22	H	NH	-CO-	Z
137	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃) CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	E
138	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃) CH ₂ Q22	H	NH	-CO-	Z
139	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q22	H	NH	-CO-	E
140	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q22	H	NH	-CO-	Z
141	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	E
142	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	Z
143	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	E
144	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	Z
145	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	E
146	H	Me	(CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	Z
147	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	E
148	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	Z
149	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	E
150	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	Z
151	H	Me	CH(CH ₃) (CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	E
152	H	Me	CH(CH ₃) (CH ₂) ₄ Q23	H	NH	-CO-	Z
153	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃) CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	E
154	H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CO-	Z
155	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q23	H	NH	-CO-	E

【0036】

【表8】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
156	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q23	H	NH	-CO-	Z
157	H	Me	(CH ₂) ₄ Q24	H	NH	-CO-	E
158	H	Me	(CH ₂) ₄ Q24	H	NH	-CO-	Z
159	H	Me	(CH ₂) ₄ Q24	H	NH	-CO-	E

27

160	H	Me	(CH ₂) ₃ , Q24	H	NH	-CO-	Z
161	H	Me	(CH ₂) ₃ , Q24	H	NH	-CO-	E
162	H	Me	(CH ₂) ₃ , Q24	H	NH	-CO-	Z
163	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	E
164	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	Z
165	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	E
166	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	Z
167	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ , Q24	H	NH	-CO-	E
168	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ , Q24	H	NH	-CO-	Z
169	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	E
170	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ , Q24	H	NH	-CO-	Z
171	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃), Q24	H	NH	-CO-	E
172	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃), Q24	H	NH	-CO-	Z
173	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q25	H	NH	-CO-	E
174	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q25	H	NH	-CO-	Z
175	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q25	H	NH	-CO-	E
176	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q25	H	NH	-CO-	Z
177	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q25	H	NH	-CO-	E

28

【0037】

20 【表9】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
178	H	Me	(CH ₂) ₃ , Q25	H	NH	-CO-	Z
179	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	E
180	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	Z
181	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	E
182	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	Z
183	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ , Q25	H	NH	-CO-	E
184	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ , Q25	H	NH	-CO-	Z
185	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	E
186	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ , Q25	H	NH	-CO-	Z
187	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃), Q25	H	NH	-CO-	E
188	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃), Q25	H	NH	-CO-	Z
189	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	E
190	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	Z
191	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	E
192	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	Z
193	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	E
194	H	Me	(CH ₂) ₄ , Q26	H	NH	-CO-	Z
195	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q26	H	NH	-CO-	E
196	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ , Q26	H	NH	-CO-	Z
197	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q26	H	NH	-CO-	E
198	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ , Q26	H	NH	-CO-	Z
199	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ , Q26	H	NH	-CO-	E

【0038】

【表10】

表 I (続)

29				30			
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
200	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q26	H	NH	-CO-	Z
201	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CO-	E
202	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CO-	Z
203	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q26	H	NH	-CO-	E
204	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) Q26	H	NH	-CO-	Z
205	H	Me	CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
206	H	Me	CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
207	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
208	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
209	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
210	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
211	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
212	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
213	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
214	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
215	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	E
216	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CO-	Z
217	H	Me	CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	E
218	H	Me	CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
219	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	E
220	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
221	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	E

【0039】

【表 11】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
222	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
223	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ H	H	NH	-CO-	E
224	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
225	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	E
226	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
227	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	E
228	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CO-	Z
229	H	Me	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	H	NH	-CO-	E
230	H	Me	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	H	NH	-CO-	Z
231	H	Me	CH ₂ CH(OH)(CH ₃), OEt	H	NH	-CO-	E
232	H	Me	CH ₂ CH(OH)(CH ₃), OEt	H	NH	-CO-	Z
233	H	Me	(CH ₂), NEt ₂	H	NH	-CO-	E
234	H	Me	(CH ₂), NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
235	H	Me	(CH ₂), NEt ₂	H	NH	-CO-	E
236	H	Me	(CH ₂), NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
237	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CO-	E
238	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
239	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CO-	E
240	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
241	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), NEt ₂	H	NH	-CO-	E

31

32

242	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
243	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ NEt ₂	H	NH	-CO-	E

【0040】

【表 12】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
244	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ NEt ₂	H	NH	-CO-	Z
245	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
246	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
247	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
248	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
249	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
250	H	Me	(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
251	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
252	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
253	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
254	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
255	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
256	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
257	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	E
258	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q13·HCl	H	NH	-CO-	Z
259	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
260	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
261	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
262	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
263	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
264	H	Me	(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
265	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E

【0041】

【表 13】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
266	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
267	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
268	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
269	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
270	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
271	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	E
272	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q14·HCl	H	NH	-CO-	Z
273	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
274	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
275	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
276	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
277	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
278	H	Me	(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
279	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E

33

34

280	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
281	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
282	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
283	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
284	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
285	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q15·HCl	H	NH	-CO-	E
286	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q15·HCl	H	NH	-CO-	Z
287	H	Me	(CH ₂) ₆ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E

【0042】

10 【表 1 4】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
288	H	Me	(CH ₂) ₆ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
289	H	Me	(CH ₂) ₇ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
290	H	Me	(CH ₂) ₈ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
291	H	Me	(CH ₂) ₉ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
292	H	Me	(CH ₂) ₁₀ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
293	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
294	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
295	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
296	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
297	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
298	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
299	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q16·HCl	H	NH	-CO-	E
300	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q16·HCl	H	NH	-CO-	Z
301	H	Me	(CH ₂) ₇ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
302	H	Me	(CH ₂) ₈ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
303	H	Me	(CH ₂) ₉ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
304	H	Me	(CH ₂) ₁₀ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
305	H	Me	(CH ₂) ₁₁ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
306	H	Me	(CH ₂) ₁₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
307	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
308	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
309	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E

【0043】

【表 1 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
310	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
311	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
312	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
313	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	E
314	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CO-	Z
315	H	Me	(CH ₂) ₁₂ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	E
316	H	Me	(CH ₂) ₁₃ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	Z
317	H	Me	(CH ₂) ₁₄ Q18·2HCl	H	NH	-CO-	E

35

36

318	H	Me	$(CH_2)_4, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
319	H	Me	$(CH_2)_4, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
320	H	Me	$(CH_2)_4, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
321	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
322	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
323	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
324	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
325	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
326	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
327	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
328	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q18 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
329	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
330	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
331	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E

【0044】

【表 16】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
332	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
333	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
334	H	Me	$(CH_2)_4, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
335	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
336	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
337	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
338	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
339	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
340	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
341	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	E
342	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q19 \cdot 2HCl$	H	NH	-CO-	Z
343	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E
344	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
345	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E
346	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
347	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E
348	H	Me	$(CH_2)_4, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
349	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E
350	H	Me	$CH(CH_3)CH_2, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
351	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E
352	H	Me	$CH(CH_3)CH_2CH_2, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
353	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E

【0045】

【表 17】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
354	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	Z
355	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3, Q21 \cdot HCl$	H	NH	-CO-	E

37									
356	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q21·HCl	H	NH	-CO-	Z		
357	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
358	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
359	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
360	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
361	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
362	H	Me	(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
363	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
364	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
365	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
366	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
367	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
368	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
369	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	E		
370	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q28·HCl	H	NH	-CO-	Z		
371	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	E		
372	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z		
373	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	E		
374	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z		
375	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	E		

【0046】

【表 18】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
376	H	Me	(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z
377	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CO-	E
378	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z
379	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CO-	E
380	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z
381	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	E
382	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z
383	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	E
384	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q30·HCl	H	NH	-CO-	Z
385	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
386	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
387	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
388	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
389	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
390	H	Me	(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
391	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
392	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
393	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
394	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
395	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	E
396	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
397	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q31·HCl	H	NH	-CO-	E

【0047】

50 【表 19】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
398	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q31·HCl	H	NH	-CO-	Z
399	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
400	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
401	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
402	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
403	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
404	H	Me	(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
405	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
406	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
407	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
408	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
409	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
410	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
411	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	E
412	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ Q32·HCl	H	NH	-CO-	Z
413	H	Me	CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CO-	E
414	H	Me	CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CO-	Z
415	H	Me	(CH ₂) ₄ CONEt ₂	H	NH	-CO-	E
416	H	Me	(CH ₂) ₄ CONEt ₂	H	NH	-CO-	Z
417	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CO-	E
418	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CO-	Z
419	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CONEt ₂	H	NH	-CO-	E

【0048】

【表20】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
420	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ CONEt ₂	H	NH	-CO-	Z
421	H	Me	CH ₂ COQ13	H	NH	-CO-	E
422	H	Me	CH ₂ COQ13	H	NH	-CO-	Z
423	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	E
424	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	Z
425	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	E
426	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	Z
427	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ13	H	NH	-CO-	E
428	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ13	H	NH	-CO-	Z
429	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	E
430	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ13	H	NH	-CO-	Z
431	H	Me	CH ₂ COQ14	H	NH	-CO-	E
432	H	Me	CH ₂ COQ14	H	NH	-CO-	Z
433	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ14	H	NH	-CO-	E
434	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ14	H	NH	-CO-	Z
435	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ14	H	NH	-CO-	E
436	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ14	H	NH	-CO-	Z
437	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ14	H	NH	-CO-	E

41								42
438	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ14	H	NH	-CO-		Z
439	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ14	H	NH	-CO-		E
440	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ14	H	NH	-CO-		Z
441	H	Me	CH ₂ COQ15	H	NH	-CO-		E

【0049】

【表 2 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
442	H	Me	CH ₂ COQ15	H	NH	-CO-	Z
443	H	Me	(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	E
444	H	Me	(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	Z
445	H	Me	(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	E
446	H	Me	(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	Z
447	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ15	H	NH	-CO-	E
448	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ15	H	NH	-CO-	Z
449	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	E
450	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ15	H	NH	-CO-	Z
451	H	Me	CH ₂ COQ16	H	NH	-CO-	E
452	H	Me	CH ₂ COQ16	H	NH	-CO-	Z
453	H	Me	(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	E
454	H	Me	(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	Z
455	H	Me	(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	E
456	H	Me	(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	Z
457	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ16	H	NH	-CO-	E
458	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ16	H	NH	-CO-	Z
459	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	E
460	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ16	H	NH	-CO-	Z
461	H	Me	CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CO-	E
462	H	Me	CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CO-	Z
463	H	Me	(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	E

【0050】

【表 2 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
464	H	Me	(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	Z
465	H	Me	(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	E
466	H	Me	(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	Z
467	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CO-	E
468	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CO-	Z
469	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	E
470	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ17·HCl	H	NH	-CO-	Z
471	H	Me	CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	E
472	H	Me	CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
473	H	Me	(CH ₂),COQ18·HCl	H	NH	-CO-	E
474	H	Me	(CH ₂),COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
475	H	Me	(CH ₂),COQ18·HCl	H	NH	-CO-	E

43

44

476	H	Me	(CH ₂) ₈ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
477	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	E
478	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
479	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	E
480	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ18·HCl	H	NH	-CO-	Z
481	H	Me	CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	E
482	H	Me	CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	Z
483	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	E
484	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	Z
485	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	E

【0051】

【表23】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
486	H	Me	(CH ₂) ₈ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	Z
487	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	E
488	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	Z
489	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	E
490	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ19·HCl	H	NH	-CO-	Z
491	H	Me	CH ₂ COQ21	H	NH	-CO-	E
492	H	Me	CH ₂ COQ21	H	NH	-CO-	Z
493	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ21	H	NH	-CO-	E
494	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ21	H	NH	-CO-	Z
495	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ21	H	NH	-CO-	E
496	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ21	H	NH	-CO-	Z
497	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ21	H	NH	-CO-	E
498	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ21	H	NH	-CO-	Z
499	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ21	H	NH	-CO-	E
500	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ21	H	NH	-CO-	Z
501	H	Me	CH ₂ COQ28	H	NH	-CO-	E
502	H	Me	CH ₂ COQ28	H	NH	-CO-	Z
503	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ28	H	NH	-CO-	E
504	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ28	H	NH	-CO-	Z
505	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ28	H	NH	-CO-	E
506	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ28	H	NH	-CO-	Z
507	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ28	H	NH	-CO-	E

【0052】

40 【表24】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
508	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ28	H	NH	-CO-	Z
509	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ28	H	NH	-CO-	E
510	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₇ COQ28	H	NH	-CO-	Z
511	H	Me	CH ₂ COQ30	H	NH	-CO-	E
512	H	Me	CH ₂ COQ30	H	NH	-CO-	Z
513	H	Me	(CH ₂) ₉ COQ30	H	NH	-CO-	E

45

46

514	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ30	H	NH	-CO-	Z
515	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ30	H	NH	-CO-	E
516	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ30	H	NH	-CO-	Z
517	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ30	H	NH	-CO-	E
518	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ30	H	NH	-CO-	Z
519	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ30	H	NH	-CO-	E
520	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ30	H	NH	-CO-	Z
521	H	Me	CH ₂ COQ31	H	NH	-CO-	E
522	H	Me	CH ₂ COQ31	H	NH	-CO-	Z
523	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ31	H	NH	-CO-	E
524	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ31	H	NH	-CO-	Z
525	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ31	H	NH	-CO-	E
526	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ31	H	NH	-CO-	Z
527	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ31	H	NH	-CO-	E
528	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ31	H	NH	-CO-	Z
529	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ31	H	NH	-CO-	E

【0053】

【表 2 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
530	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ31	H	NH	-CO-	Z
531	H	Me	CH ₂ COQ32	H	NH	-CO-	E
532	H	Me	CH ₂ COQ32	H	NH	-CO-	Z
533	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CO-	E
534	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CO-	Z
535	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CO-	E
536	H	Me	(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CO-	Z
537	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ32	H	NH	-CO-	E
538	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ32	H	NH	-CO-	Z
539	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ32	H	NH	-CO-	E
540	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ32	H	NH	-CO-	Z
541	CONH ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
542	CONH ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
543	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
544	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
545	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
546	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
547	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
548	(CH ₂) ₂ Ph	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
549	(CH ₂) ₂ Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
550	(CH ₂) ₂ Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
551	(CH ₂) ₂ Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0054】

【表 2 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
-----	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	------

47

48

552	(CH ₃), Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
553	(CH ₃), Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
554	(CH ₃), Q5	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
555	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
556	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
557	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
558	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
559	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
560	(CH ₃), Q22	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
561	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
562	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
563	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
564	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
565	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
566	(CH ₃), Q23	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
567	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
568	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
569	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
570	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
571	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
572	(CH ₃), Q24	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
573	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【 0 0 5 5 】

【表 2 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
574	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
575	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
576	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
577	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
578	(CH ₃), Q25	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
579	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
580	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
581	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
582	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
583	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
584	(CH ₃), Q26	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
585	(CH ₃), CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
586	(CH ₃), CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
587	(CH ₃), CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
588	(CH ₃), CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
589	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
590	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
591	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
592	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ Et	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
593	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
594	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
595	(CH ₃), OCH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0056】

【表 28】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
596	(CH ₂) ₃ OCH ₂ CO ₂ H	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
597	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₂ OEt	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
598	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₂ OEt	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
599	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
600	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
601	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
602	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
603	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
604	(CH ₂) ₃ NEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
605	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
606	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
607	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
608	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
609	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
610	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
611	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
612	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
613	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
614	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
615	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
616	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
617	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0057】

30 【表 29】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
618	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
619	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
620	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
621	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
622	(CH ₂) ₃ Q15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
623	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
624	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
625	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
626	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
627	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
628	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
629	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
630	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
631	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
632	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
633	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

51

52

634	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
635	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
636	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
637	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
638	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
639	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0058】

【表 3 0】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
640	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
641	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
642	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
643	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
644	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
645	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
646	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
647	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
648	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
649	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
650	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
651	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
652	(CH ₂) ₅ Q21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
653	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
654	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
655	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
656	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
657	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
658	(CH ₂) ₅ Q28·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
659	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
660	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
661	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0059】

【表 3 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
662	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
663	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
664	(CH ₂) ₅ Q30·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
665	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
666	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
667	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
668	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
669	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
670	(CH ₂) ₅ Q31·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
671	(CH ₂) ₅ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

53

54

672	(CH ₂) ₂ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
673	(CH ₂) ₂ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
674	(CH ₂) ₂ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
675	(CH ₂) ₂ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
676	(CH ₂) ₂ Q32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
677	(CH ₂) ₂ CONEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
678	(CH ₂) ₂ CONEt ₂	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
679	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
680	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
681	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
682	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
683	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0060】

【表 3 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
684	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
685	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
686	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
687	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
688	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
689	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
690	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
691	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
692	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
693	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
694	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
695	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
696	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
697	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
698	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
699	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
700	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
701	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
702	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
703	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
704	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
705	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0061】

【表 3 3】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
706	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
707	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
708	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
709	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

55

56

710	(CH ₃) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
711	(CH ₃) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
712	(CH ₃) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
713	(CH ₃) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
714	(CH ₃) ₂ COQ18·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
715	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
716	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
717	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
718	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
719	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
720	(CH ₃) ₂ COQ19·HCl	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
721	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
722	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
723	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
724	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
725	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
726	(CH ₃) ₂ COQ21	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
727	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0062】

20 【表34】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
728	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
729	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
730	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
731	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
732	(CH ₃) ₂ COQ28	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
733	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
734	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
735	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
736	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
737	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
738	(CH ₃) ₂ COQ30	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
739	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
740	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
741	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
742	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
743	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
744	(CH ₃) ₂ COQ31	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
745	(CH ₃) ₂ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
746	(CH ₃) ₂ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
747	(CH ₃) ₂ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E
748	(CH ₃) ₂ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
749	(CH ₃) ₂ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	E

【0063】

【表35】

表 I (続)

57

58

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
750	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	Q2	H	NH	-CO-	Z
751	CH ₂ CO ₂ Me	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
752	CH ₂ CO ₂ Me	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
753	CH ₂ CH(OH) Et	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
754	CH ₂ CH(OH) Et	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
755	(CH ₂) ₅ CO ₂ Et	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
756	(CH ₂) ₅ CO ₂ Et	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
757	CH ₂ CO ₂ H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
758	CH ₂ CO ₂ H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
759	(CH ₂) ₅ CO ₂ H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
760	(CH ₂) ₅ CO ₂ H	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
761	CH ₂ CO ₂ NEt ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
762	CH ₂ CO ₂ NEt ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
763	(CH ₂) ₅ CONEt ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
764	(CH ₂) ₅ CONEt ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
765	CONH ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
766	CONH ₂	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
767	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
768	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
769	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
770	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
771	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

【0064】

【表 3 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
772	(CH ₂) ₅ Ph	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
773	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
774	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
775	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
776	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
777	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
778	(CH ₂) ₅ Q5	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
779	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
780	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
781	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
782	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
783	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
784	(CH ₂) ₅ Q22	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
785	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
786	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
787	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
788	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
789	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
790	(CH ₂) ₅ Q23	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
791	(CH ₂) ₅ Q24	Me	CH(CH ₃) CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

59

60

792	$(\text{CH}_2)_4$, Q24	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
793	$(\text{CH}_2)_4$, Q24	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E

[0 0 6 5]

【表 3 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
794	$(\text{CH}_2)_4$, Q24	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
795	$(\text{CH}_2)_4$, Q24	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
796	$(\text{CH}_2)_4$, Q24	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
797	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
798	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
799	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
800	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
801	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
802	$(\text{CH}_2)_4$, Q25	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
803	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
804	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
805	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
806	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
807	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
808	$(\text{CH}_2)_4$, Q26	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
809	$(\text{CH}_2)_4$, CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
810	$(\text{CH}_2)_4$, CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
811	$(\text{CH}_2)_4$, CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
812	$(\text{CH}_2)_4$, CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
813	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
814	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
815	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z

[0 0 6 6]

【表 3 8】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
816	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ Et	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
817	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
818	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
819	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
820	$(\text{CH}_2)_4$, OCH ₂ CO ₂ H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
821	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
822	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
823	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
824	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
825	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
826	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
827	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
828	$(\text{CH}_2)_4$, NEt ₂	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
829	$(\text{CH}_2)_4$, Q13·HCl	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E

61							62
830	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
831	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
832	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
833	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
834	(CH ₂) ₃ Q13·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
835	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
836	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
837	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

【0067】

10 【表 3 9】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
838	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
839	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
840	(CH ₂) ₃ Q14·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
841	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
842	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
843	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
844	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
845	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
846	(CH ₂) ₃ Q15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
847	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
848	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
849	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
850	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
851	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
852	(CH ₂) ₃ Q16·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
853	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
854	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
855	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
856	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
857	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
852	(CH ₂) ₃ Q17·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
853	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

【0068】

【表 4 0】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
854	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
855	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
856	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
857	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
858	(CH ₂) ₃ Q18·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
859	(CH ₂) ₃ Q19·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
860	(CH ₂) ₃ Q19·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
861	(CH ₂) ₃ Q19·2HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

63

64

862	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q19} \cdot 2\text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
863	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q19} \cdot 2\text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
864	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q19} \cdot 2\text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
865	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
866	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
867	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
868	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
869	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
870	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q21}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
871	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
872	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
873	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
874	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
875	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E

【0069】

【表 4 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
876	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q28} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
877	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
878	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
879	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
880	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
881	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
882	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q30} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
883	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
884	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
885	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
886	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
887	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
888	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q31} \cdot \text{HCl}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
889	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
890	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
891	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
892	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
893	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
894	$(\text{CH}_2)_5, \text{Q32}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
895	$(\text{CH}_2)_5, \text{CONEt}_2$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E
896	$(\text{CH}_2)_5, \text{CONEt}_2$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
897	$(\text{CH}_2)_5, \text{COQ13}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E

【0070】

【表 4 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
898	$(\text{CH}_2)_5, \text{COQ13}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	Z
899	$(\text{CH}_2)_5, \text{COQ13}$	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Ph}$	H	NH	-CO-	E

65

900	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
901	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
902	(CH ₂) ₂ COQ13	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
903	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
904	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
905	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
906	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
907	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
908	(CH ₂) ₂ COQ14	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
909	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
910	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
911	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
912	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
913	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
914	(CH ₂) ₂ COQ15	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
915	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
916	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
917	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
918	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
919	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

66

【0071】

【表43】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
920	(CH ₂) ₂ COQ16	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
921	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
922	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
923	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
924	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
925	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
926	(CH ₂) ₂ COQ17·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
927	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
928	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
929	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
930	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
931	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
932	(CH ₂) ₂ COQ18·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
933	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
934	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
935	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
936	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
937	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
938	(CH ₂) ₂ COQ19·HCl	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
939	(CH ₂) ₂ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
940	(CH ₂) ₂ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
941	(CH ₂) ₂ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

【0072】

50 【表44】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
942	(CH ₂) ₅ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
943	(CH ₂) ₅ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
944	(CH ₂) ₅ COQ21	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
945	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
946	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
947	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
948	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
949	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
950	(CH ₂) ₅ COQ28	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
951	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
952	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
953	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
954	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
955	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
956	(CH ₂) ₅ COQ30	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
957	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
958	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
959	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
960	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
961	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
962	(CH ₂) ₅ COQ31	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
963	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E

[0073]

【表 4 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
964	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
965	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
966	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
967	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	E
968	(CH ₂) ₅ COQ32	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Ph	H	NH	-CO-	Z
969	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CO ₂ Me	-CO-	E
970	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CO ₂ Me	-CO-	Z
971	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CH(OH)Et	-CO-	E
972	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CH(OH)Et	-CO-	Z
973	H	Me	Q2	H	N(CH ₂) ₅ CO ₂ Et	-CO-	E
974	H	Me	Q2	H	N(CH ₂) ₅ CO ₂ Et	-CO-	Z
975	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CO ₂ H	-CO-	E
976	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CO ₂ H	-CO-	Z
977	H	Me	Q2	H	N(CH ₂) ₅ CO ₂ H	-CO-	E
978	H	Me	Q2	H	N(CH ₂) ₅ CO ₂ H	-CO-	Z
979	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CONEt ₂	-CO-	E
980	H	Me	Q2	H	NCH ₂ CONEt ₂	-CO-	Z
981	H	Me	Q2	H	N(CH ₂) ₅ CONEt ₂	-CO-	E

69					70
982	H	Me	Q2	H N(CH ₂) ₃ CONEt ₂	-CO- Z
983	H	Me	Q2	H CONH ₂	-CO- E
984	H	Me	Q2	H CONH ₂	-CO- Z
985	H	Me	Q2	H (CH ₂) ₃ Ph	-CO- E

【0074】

【表 4 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
986	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Ph	-CO-	Z
987	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Ph	-CO-	E
988	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Ph	-CO-	Z
989	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Ph	-CO-	E
990	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Ph	-CO-	Z
991	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CO-	E
992	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CO-	Z
993	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CH ₂ -	E
994	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CO-	Z
995	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CO-	E
996	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q5	-CO-	Z
997	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	E
998	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	Z
999	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	E
1000	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	Z
1001	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	E
1002	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q22	-CO-	Z
1003	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	E
1004	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	Z
1005	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	E
1006	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	Z
1007	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	E

【0075】

【表 4 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1008	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q23	-CO-	Z
1009	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	E
1100	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	Z
1101	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	E
1102	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	Z
1103	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	E
1104	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q24	-CO-	Z
1105	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q25	-CO-	E
1106	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q25	-CO-	Z
1107	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q25	-CO-	E
1108	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q25	-CO-	Z
1109	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₃ Q25	-CO-	E

71				72			
1110	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q25	-CO-	Z
1111	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	E
1112	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	Z
1113	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	E
1114	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	Z
1115	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	E
1116	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q26	-CO-	Z
1117	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ CO ₂ Et	-CO-	E
1118	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ CO ₂ Et	-CO-	Z
1119	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ CO ₂ H	-CO-	E

【0076】

【表 4 8】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1120	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ CO ₂ H	-CO-	Z
1121	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ Et	-CO-	E
1122	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ Et	-CO-	Z
1123	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ Et	-CO-	E
1124	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ Et	-CO-	Z
1125	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ H	-CO-	E
1126	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ H	-CO-	Z
1127	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ H	-CO-	E
1128	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ OCH ₂ CO ₂ H	-CO-	Z
1129	H	Me	Q2	H	CH ₂ CH(OH) CH ₂ CH ₂ OE t	-CO-	E
1130	H	Me	Q2	H	CH ₂ CH(OH) CH ₂ CH ₂ OE t	-CO-	Z
1131	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	E
1132	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	Z
1133	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	E
1134	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	Z
1135	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	E
1136	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ NEt ₂	-CO-	Z
1137	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	E
1138	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	Z
1139	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	E
1140	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	Z
1141	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	E

【0077】

40 【表 4 9】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1142	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q13·HCl	-CO-	Z
1143	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q14·HCl	-CO-	E
1144	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q14·HCl	-CO-	Z
1145	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q14·HCl	-CO-	E
1146	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q14·HCl	-CO-	Z
1147	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ Q14·HCl	-CO-	E

73						74
1148	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q14 \cdot HCl$	-CO- Z
1149	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- E
1150	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- Z
1151	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- E
1152	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- Z
1153	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- E
1154	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q15$	-CO- Z
1155	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- E
1156	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- Z
1157	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- E
1158	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- Z
1159	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- E
1160	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q16 \cdot HCl$	-CO- Z
1161	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO- E
1162	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO- Z
1163	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO- E

【0078】

【表 5 0】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1164	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1165	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1166	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q17 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1167	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1168	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1169	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1170	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1171	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1172	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q18 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1173	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1174	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1175	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1176	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1177	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	E
1178	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q19 \cdot 2HCl$	-CO-	Z
1179	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	E
1180	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	Z
1181	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	E
1182	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	Z
1183	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	E
1184	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q21$	-CO-	Z
1185	H	Me	Q2	H	$(CH_2)_5 Q28 \cdot HCl$	-CO-	E

【0079】

【表 5 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
-----	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	------

75

1186	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q28·HCl	-CO-	Z
1187	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q28·HCl	-CO-	E
1188	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q28·HCl	-CO-	Z
1189	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q28·HCl	-CO-	E
1190	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q28·HCl	-CO-	Z
1191	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	E
1192	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	Z
1193	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	E
1194	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	Z
1195	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	E
1196	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q30·HCl	-CO-	Z
1197	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	E
1198	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	Z
1199	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	E
1200	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	Z
1201	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	E
1202	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q31·HCl	-CO-	Z
1203	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	E
1204	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	Z
1205	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	E
1206	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	Z
1207	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	E

76

[0080]

【表 5 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1208	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ Q32	-CO-	Z
1209	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ CONE1 ₂	-CO-	E
1210	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ CONE1 ₂	-CO-	Z
1211	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	E
1212	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	Z
1213	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	E
1214	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	Z
1215	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	E
1216	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ13	-CO-	Z
1217	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	E
1218	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	Z
1219	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	E
1220	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	Z
1221	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	E
1222	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ14	-CO-	Z
1223	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	E
1224	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	Z
1225	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	E
1226	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	Z
1227	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	E
1228	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ15	-CO-	Z
1229	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₂ COQ16	-CO-	E

【0081】

【表 5 3】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1230	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ16	-CO-	Z
1231	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ16	-CO-	E
1232	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ16	-CO-	Z
1233	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ16	-CO-	E
1334	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ16	-CO-	Z
1235	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	E
1236	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	Z
1237	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	E
1238	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	Z
1239	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	E
1240	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	-CO-	Z
1241	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	E
1242	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	Z
1243	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	E
1244	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	Z
1245	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	E
1246	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	-CO-	Z
1247	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	E
1248	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	Z
1249	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	E
1250	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	Z
1251	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	E

【0082】

30 【表 5 4】
表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1252	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	-CO-	Z
1253	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	E
1254	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	Z
1255	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	E
1256	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	Z
1257	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	E
1258	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ21	-CO-	Z
1259	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	E
1260	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	Z
1261	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	E
1262	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	Z
1263	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	E
1264	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ28	-CO-	Z
1265	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ30	-CO-	E
1266	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ30	-CO-	Z
1267	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₅ COQ30	-CO-	E

79							80
1268	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ30	-CO-	Z
1269	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ30	-CO-	E
1270	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ30	-CO-	Z
1271	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	E
1272	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	Z
1273	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	E

【0083】

【表 5 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1274	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	Z
1275	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	E
1276	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ31	-CO-	Z
1277	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	E
1278	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	Z
1279	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	E
1280	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	Z
1281	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	E
1282	H	Me	Q2	H	(CH ₂) ₄ COQ32	-CO-	Z
1283	H	Me	Q2	H	NH	-CH ₂ -	E
1284	H	Me	Q2	H	NH	-CH ₂ -	Z
1285	Me	Me	Q2	H	NMe	-CH ₂ -	E
1286	Me	Me	Q2	H	NMe	-CH ₂ -	Z
1287	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1288	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1289	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NMe	-CH ₂ -	E
1290	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NMe	-CH ₂ -	Z
1291	H	Me	CH ₂ COQ18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1292	H	Me	CH ₂ COQ18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1293	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1294	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1295	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	E

【0084】

【表 5 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1296	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	Z
1297	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NMe	-CH ₂ -	E
1298	H	Me	(CH ₂) ₄ Q18·2HCl	H	NMe	-CH ₂ -	Z
1299	H	Me	(CH ₂) ₄ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1300	H	Me	(CH ₂) ₄ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1301	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	Z
1302	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	E
1303	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	Z
1304	H	Me	(CH ₂) ₄ Ph	H	NH	-CH ₂ -	E
1305	H	Me	(CH ₂) ₄ N(Et) ₂ ·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

81				82	
1306	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{N}(\text{Et})_2 \cdot \text{HCl}$	H	NH $-\text{CH}_2-$ Z
1307	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CONEt}_2$	H	NH $-\text{CH}_2-$ E
1308	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CONEt}_2$	H	NH $-\text{CH}_2-$ Z
1309	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Et}$	H	NH $-\text{CH}_2-$ E
1310	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Et}$	H	NH $-\text{CH}_2-$ Z
1311	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Na}$	H	NH $-\text{CH}_2-$ E
1312	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Na}$	H	NH $-\text{CH}_2-$ Z
1313	H	Me	Q2	H	NMe $-\text{CH}_2-$ E
1314	H	Me	Q2	H	NMe $-\text{CH}_2-$ Z
1315	$\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{Me}$	Me	Q2	H	NMe $-\text{CH}_2-$ E
1316	$\text{CH}_2 \text{CH}(\text{OH}) \text{CH}_2 \text{CH}_3$	Me	Q2	H	NMe $-\text{CH}_2-$ E
1317	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Et}$	Me	Q2	H	NMe $-\text{CH}_2-$ E

【0085】

【表 5 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1318	$\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{H}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	E
1319	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{H}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	E
1320	$\text{CH}_2 \text{CON}(\text{Et})_2$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	E
1321	$(\text{CH}_2)_3 \text{CONEt}_2$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	E
1322	$\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{Me}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1323	$\text{CH}_2 \text{CH}(\text{OH}) \text{CH}_2 \text{CH}_3$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1324	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{Et}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1325	$\text{CH}_2 \text{CO}_2 \text{H}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1326	$\text{CH}_2 \text{CONEt}_2$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1327	$(\text{CH}_2)_3 \text{CONEt}_2$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1328	$(\text{CH}_2)_3 \text{CO}_2 \text{H}$	Me	Q2	H	NMe	$-\text{CH}_2-$	Z
1329	H	Me	Q1	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1330	H	Me	Q1	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1331	H	Me	Q3	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1332	H	Me	Q3	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1334	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1335	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1336	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1337	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1338	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) (\text{CH}_2)_3 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1339	H	Me	$\text{CH}(\text{CH}_3) (\text{CH}_2)_3 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1340	H	Me	$\text{CH}_2 \text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E

【0086】

【表 5 8】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1341	H	Me	$\text{CH}_2 \text{CH}(\text{CH}_3) \text{CH}_2 \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1342	H	Me	$\text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{CH}(\text{CH}_3) \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E
1343	H	Me	$\text{CH}_2 \text{CH}_2 \text{CH}(\text{CH}_3) \text{Ph}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	Z
1344	H	Me	$(\text{CH}_2)_3 \text{Q4}$	H	NH	$-\text{CH}_2-$	E

83

84

1345	H	Me	$(CH_2)_4 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1346	H	Me	$(CH_2)_4 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1347	H	Me	$(CH_2)_4 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1348	H	Me	$(CH_2)_4 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1349	H	Me	$(CH_2)_4 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1350	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1351	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1352	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1353	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1354	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1355	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1356	H	Me	$CH_2 CH(CH_3)CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1357	H	Me	$CH_2 CH(CH_3)CH_2 Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1358	H	Me	$CH_2 CH_2 CH(CH_3) Q4$	H	NH	$-CH_2-$	E
1359	H	Me	$CH_2 CH_2 CH(CH_3) Q4$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1360	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1361	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1362	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E

【0087】

20 【表59】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1363	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1364	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1365	H	Me	$(CH_2)_4 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1366	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1367	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1368	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1369	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1370	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1371	H	Me	$CH(CH_3)(CH_2)_3 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1372	H	Me	$CH_2 CH(CH_3)CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1373	H	Me	$CH_2 CH(CH_3)CH_2 Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1374	H	Me	$CH_2 CH_2 CH(CH_3) Q5$	H	NH	$-CH_2-$	E
1375	H	Me	$CH_2 CH_2 CH(CH_3) Q5$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1376	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	E
1377	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1378	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	E
1379	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1380	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	E
1381	H	Me	$(CH_2)_4 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1382	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	E
1383	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	Z
1384	H	Me	$CH(CH_3)CH_2 CH_2 Q7$	H	NH	$-CH_2-$	E

【0088】

【表60】

表 I (続)

85							86
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1385	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q7	H	NH	-CH ₂ -	Z
1386	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q7	H	NH	-CH ₂ -	E
1387	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q7	H	NH	-CH ₂ -	Z
1388	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CH ₂ -	E
1389	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q7	H	NH	-CH ₂ -	Z
1390	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q7	H	NH	-CH ₂ -	E
1391	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q7	H	NH	-CH ₂ -	Z
1392	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1393	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1394	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1395	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1396	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1397	H	Me	(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1398	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1499	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1400	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1401	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1402	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1403	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1404	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	E
1405	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1406	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q10	H	NH	-CH ₂ -	E

【0089】

【表 6 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1407	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q10	H	NH	-CH ₂ -	Z
1408	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1409	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1410	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1411	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1412	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1413	H	Me	(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1414	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1415	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1416	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1417	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1418	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1419	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1420	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1421	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1422	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q22	H	NH	-CH ₂ -	E
1423	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q22	H	NH	-CH ₂ -	Z
1424	H	Me	(CH ₂) ₃ Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1425	H	Me	(CH ₂) ₃ Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1426	H	Me	(CH ₂) ₃ Q23	H	NH	-CH ₂ -	E

87

1427	H	Me	(CH ₂), Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1428	H	Me	(CH ₂), Q23	H	NH	-CH ₂ -	E

88

【0090】

【表 6 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1429	H	Me	(CH ₂), Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1430	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1431	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1432	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1433	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1434	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1435	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1436	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1337	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1448	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q23	H	NH	-CH ₂ -	E
1439	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q23	H	NH	-CH ₂ -	Z
1440	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1441	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1442	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1443	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1445	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1446	H	Me	(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1447	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1448	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1449	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1450	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1451	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	E

【0091】

【表 6 3】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1452	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1453	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1454	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1455	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q24	H	NH	-CH ₂ -	E
1456	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q24	H	NH	-CH ₂ -	Z
1457	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1458	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1459	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1460	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1461	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1462	H	Me	(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1463	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1464	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1465	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	E

89

90

1466	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1467	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1468	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1469	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1470	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1471	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q25	H	NH	-CH ₂ -	E
1472	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q25	H	NH	-CH ₂ -	Z
1473	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	E

【0092】

10 【表 6 4】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1474	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1375	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1476	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1477	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1478	H	Me	(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1479	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1480	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1481	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1482	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1483	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1484	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1485	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1486	H	Me	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1487	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q26	H	NH	-CH ₂ -	E
1488	H	Me	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)Q26	H	NH	-CH ₂ -	Z
1489	H	Me	CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1490	H	Me	CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1491	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1492	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1493	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1494	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1495	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E

【0093】

【表 6 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1496	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1497	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1498	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1499	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	E
1500	H	Me	(CH ₂), OCH ₂ CO ₂ Et	H	NH	-CH ₂ -	Z
1501	H	Me	CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E
1502	H	Me	CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1503	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E

91

92

1504	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1505	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E
1506	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1507	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E
1508	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1509	H	Me	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E
1510	H	Me	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1511	H	Me	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	E
1512	H	Me	(CH ₂) ₂ OCH ₂ CO ₂ H	H	NH	-CH ₂ -	Z
1513	H	Me	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	H	NH	-CH ₂ -	E
1514	H	Me	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	H	NH	-CH ₂ -	Z
1515	H	Me	CH ₂ CH(OH)(CH ₃)OEt	H	NH	-CH ₂ -	E
1516	H	Me	CH ₂ CH(OH)(CH ₃)OEt	H	NH	-CH ₂ -	Z
1517	H	Me	(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E

[0094]

【表 6 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1518	H	Me	(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1519	H	Me	(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1520	H	Me	(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1521	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1522	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1523	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1524	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1525	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1526	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1527	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1528	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ NEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1529	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1530	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1531	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1532	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1533	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1534	H	Me	(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1535	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1536	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1537	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1548	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1539	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

[0095]

【表 6 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1540	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1541	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

93

94

1542	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q13·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1543	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1545	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1546	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1547	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1548	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1549	H	Me	(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1550	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1551	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1552	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1553	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1554	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1555	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1556	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1557	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q14·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1558	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1559	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1560	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1561	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1562	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

【0096】

【表 6 8】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1563	H	Me	(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1564	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1565	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1566	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1567	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1568	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1569	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1570	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1571	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q15·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1572	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1573	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1574	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1575	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1576	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1577	H	Me	(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1578	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1579	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1580	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1581	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1582	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1583	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1584	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂), Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

【0097】

50 【表 6 9】

表 I (続)

No.	R'	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1585	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q16·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1586	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1587	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1588	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1589	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1590	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1591	H	Me	(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1592	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1593	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1594	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1595	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1596	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1597	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1598	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1599	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q17·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1600	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1601	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1602	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1603	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1604	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1605	H	Me	(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1606	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

【0098】

【表70】

表 I (続)

No.	R'	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1607	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1608	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1609	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1610	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1611	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1612	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1613	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q18·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1614	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1615	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1616	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1617	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1618	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1619	H	Me	(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1620	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1621	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1622	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1623	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1624	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₅ Q19·2HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

97

1625	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q19·2HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1626	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q19·2HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1627	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q19·2HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1628	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E

98

【0 0 9 9】

【表 7 1】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1629	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1630	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1631	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1632	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1633	H	Me	(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1634	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1635	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1636	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1637	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1648	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1639	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1640	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1641	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q21·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1642	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1643	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1645	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1646	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1647	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1648	H	Me	(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1649	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1650	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1651	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E

【0 1 0 0】

【表 7 2】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1652	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1653	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1654	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1655	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1656	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₃), Q28·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1657	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1658	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1659	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1660	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1661	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E
1662	H	Me	(CH ₃), Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	Z
1663	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q30·HC1	H	NH	-CH ₂ -	E

99

100

1664	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1665	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1666	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1667	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1668	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1669	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1670	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q30·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1671	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1672	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1673	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

【0101】

【表 7 3】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1674	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1675	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1676	H	Me	(CH ₂) ₃ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1677	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1678	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1679	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1680	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1681	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1682	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1683	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1684	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q31·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1685	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1686	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1687	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1688	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1689	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1690	H	Me	(CH ₂) ₃ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1691	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1692	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1693	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1694	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1695	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

【0102】

40 【表 7 4】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1696	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1697	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1698	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ Q32·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1699	H	Me	CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1700	H	Me	CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1701	H	Me	(CH ₂) ₃ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E

101

102

1702	H	Me	(CH ₂) ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1703	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1704	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1705	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	E
1706	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CONEt ₂	H	NH	-CH ₂ -	Z
1707	H	Me	CH ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	E
1708	H	Me	CH ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	Z
1709	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	E
1710	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	Z
1711	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	E
1712	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	Z
1713	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	E
1714	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	Z
1715	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	E
1716	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ13	H	NH	-CH ₂ -	Z
1717	H	Me	CH ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	E

【0103】

【表 7 5】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1718	H	Me	CH ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	Z
1719	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	E
1720	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	Z
1721	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	E
1722	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	Z
1723	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	E
1724	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	Z
1725	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	E
1726	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ14	H	NH	-CH ₂ -	Z
1727	H	Me	CH ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	E
1728	H	Me	CH ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	Z
1729	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	E
1730	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	Z
1731	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	E
1732	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	Z
1733	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	E
1734	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	Z
1735	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	E
1736	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ COQ15	H	NH	-CH ₂ -	Z
1737	H	Me	CH ₂ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	E
1748	H	Me	CH ₂ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	Z
1739	H	Me	(CH ₂) ₂ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	E

【0104】

【表 7 6】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
-----	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---	------

103

104

1740	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	Z
1741	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	E
1742	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	Z
1743	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	E
1745	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	Z
1746	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	E
1747	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ16	H	NH	-CH ₂ -	Z
1748	H	Me	CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1749	H	Me	CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1750	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1751	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1752	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1753	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1754	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1755	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1756	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1757	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ17·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1758	H	Me	CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1759	H	Me	CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1760	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1761	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1762	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E

[0 1 0 5]

【表 7 7】

表 I (続)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1763	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1764	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1765	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1766	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1767	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ18·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1768	H	Me	CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1769	H	Me	CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1770	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1771	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1772	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1773	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1774	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1775	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1776	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	E
1777	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₄ COQ19·HCl	H	NH	-CH ₂ -	Z
1778	H	Me	CH ₂ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	E
1779	H	Me	CH ₂ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	Z
1780	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	E
1781	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	Z
1782	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	E
1783	H	Me	(CH ₂) ₅ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	Z
1784	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	E

【0106】

【表 7 8】

表 I (統)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1785	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ21	H	NH	-CH ₂ -	Z
1786	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ21	H	NH	-CH ₂ -	E
1787	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ21	H	NH	-CH ₂ -	Z
1788	H	Me	CH ₂ COQ28	H	NH	-CH ₂ -	E
1789	H	Me	CH ₂ COQ28	H	NH	-CH ₂ -	Z
1790	H	Me	(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	E
1791	H	Me	(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	Z
1792	H	Me	(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	E
1793	H	Me	(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	Z
1794	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ28	H	NH	-CH ₂ -	E
1795	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ28	H	NH	-CH ₂ -	Z
1796	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	E
1797	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ28	H	NH	-CH ₂ -	Z
1798	H	Me	CH ₂ COQ30	H	NH	-CH ₂ -	E
1799	H	Me	CH ₂ COQ30	H	NH	-CH ₂ -	Z
1800	H	Me	(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	E
1801	H	Me	(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	Z
1802	H	Me	(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	E
1803	H	Me	(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	Z
1804	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ30	H	NH	-CH ₂ -	E
1805	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ30	H	NH	-CH ₂ -	Z
1806	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	E

【0107】

30 【表 7 9】

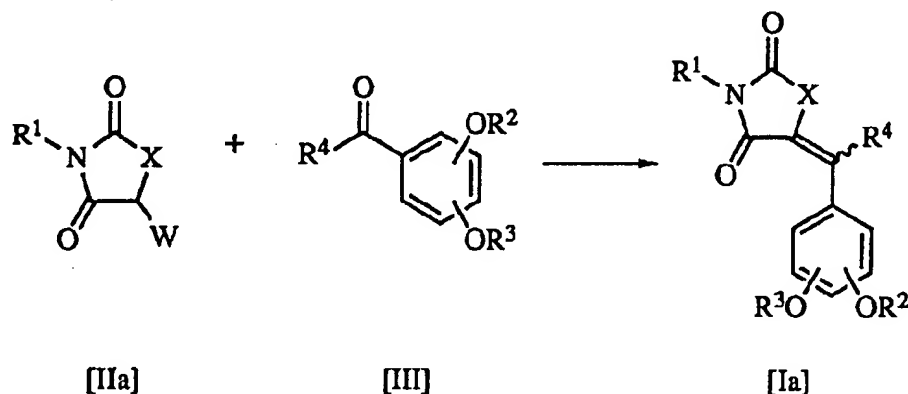
表 I (統)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	立体化学
1807	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ30	H	NH	-CH ₂ -	Z
1808	H	Me	CH ₂ COQ31	H	NH	-CH ₂ -	E
1809	H	Me	CH ₂ COQ31	H	NH	-CH ₂ -	Z
1810	H	Me	(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	E
1811	H	Me	(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	Z
1812	H	Me	(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	E
1813	H	Me	(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	Z
1814	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ31	H	NH	-CH ₂ -	E
1815	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ31	H	NH	-CH ₂ -	Z
1816	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	E
1817	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂),COQ31	H	NH	-CH ₂ -	Z
1818	H	Me	CH ₂ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	E
1819	H	Me	CH ₂ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	Z
1820	H	Me	(CH ₂),COQ32	H	NH	-CH ₂ -	E
1821	H	Me	(CH ₂),COQ32	H	NH	-CH ₂ -	Z
1822	H	Me	(CH ₂),COQ32	H	NH	-CH ₂ -	E

107						108		
1823	H	Me	(CH ₂) ₄ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	Z	
1824	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	E	
1825	H	Me	CH(CH ₃)CH ₂ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	Z	
1826	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	E	
1827	H	Me	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ COQ32	H	NH	-CH ₂ -	Z	

【0108】次に、本発明化合物の製法を説明する。本発明化合物〔I〕は例えば以下の反応式（1）～（6）で示される方法によって製造することができる。

反応式（1）



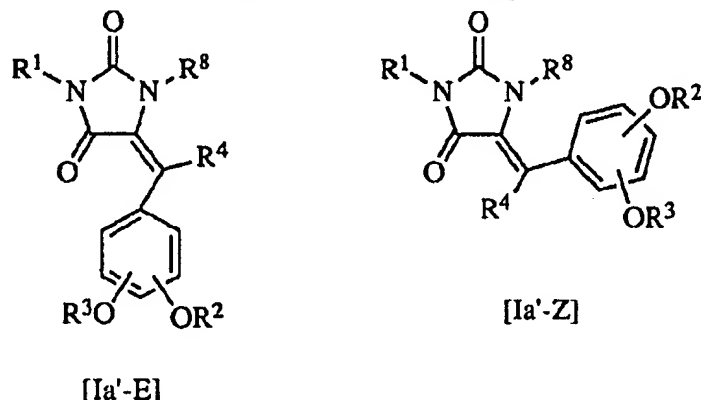
【0110】〔反応式中、R¹、R²、R³、R⁴およびXは前述の一般式〔I〕の説明と同じ意味であり；Wは水素原子または-PO(OR¹)₂（R¹は炭素数1～4の低級アルキル基を示す。）を示す。〕

【0111】反応式（1）による合成法は一般式〔IIa〕で表わされるジオン誘導体と〔III〕で表わされるカルボニル誘導体とを脱水縮合反応に付し、一般式〔Ia〕で表わされるベンジリデン誘導体を製造する方法である。上記反応においては、ベンジリデン部二重結合の立

体化学に関し、E体とZ体の二種の立体異性体の生成が考えられる。E体とZ体の生成する割合は反応の条件によっても異なるが、主として反応の遷移状態における立体的安定性によって支配されることが多い。例えばXが置換アミノ基〔NR¹（R¹は前述の説明と同じ。）〕である場合には、R⁴が立体的にかさ高い置換基である程Z体〔Ia'-Z〕よりもE体〔Ia'-E〕

【0112】

【化16】



【0113】の生成が多くなる傾向にある。また、両異性体の生成比はベンゼン環上の2つの置換基OR²、OR³の置換位置によっても影響を受け、オルソ、メタ、パラ位の順に立体的効果が強く反映することが多い。

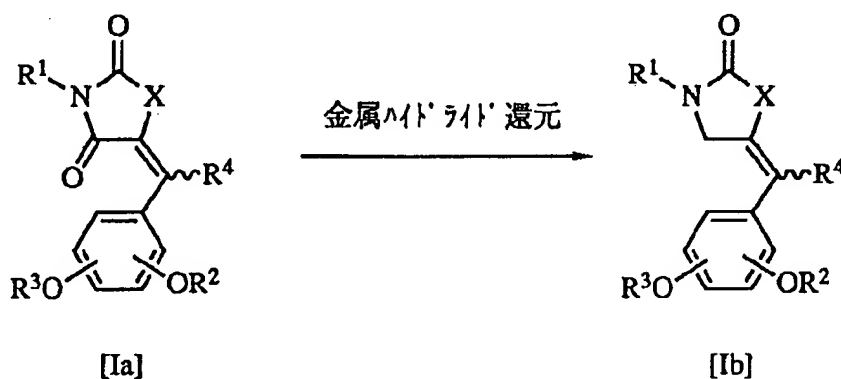
【0114】一般式〔IIa〕のジオン誘導体のうち、Wが水素原子で表わされる化合物を用いる反応においては、〔IIa〕が反応活性種エノール体を生成するような条件を設定することができるが、通常酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化

ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウムなどの無機塩基、あるいはピロリジン、ピペリジン、モルフォリン、トリエチルアミン、ジアザビシクロノナン（DBN）、ジアザビシクロウンデセン（DBU）などの有機塩基あるいはそれらの組み合わせを用いて、好結果を得ることが多い。反応に用いる溶媒としては、無機塩基を用いる場合には酢酸、プロピオン酸などの有機酸類、メタノール、エタノール、n-プロパノールなどのアルコール類、ホルムアミド、N、N-ジメチルホルムアミ

ド、N、N-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンなどのアミド類水またはジメチルスルホキシドなどの極性溶媒類が好適に用いられる。また、前述の有機塩基を用いる場合の反応溶媒としては、反応に関与しない溶媒であれば特に制限はなく、無溶媒で行うこともある。次に反応温度としては、Xの種類や用いる塩基によっても異なるが、多くの場合加熱下条件で行い、通常70~200℃の間を設定することができる。

【0115】一方、一般式〔IIa〕で示されるジオン体のうち、Wがジアルキルホスホリル基で表わされる化合物を用いる反応の場合は、一般に上述の反応条件に比較し、より緩和な条件下で反応が進行し、収率の面でも有利な結果を得ることが多い。すなわち、本反応は活性化されたイリド種を用いる。いわゆるウィティヒ (Wittig) 型の反応であり、従ってこの種の反応の際に通常用いる塩基存在下、-40℃~100℃程度の温度範囲で行うことが多い。ホスホネート〔IIa〕の製造及びそれを用いる〔III〕との反応条件については、Jou

反応式 (2)



【0119】(反応式中、R¹、R²、R³、R⁴およびXは前述の一般式〔I〕の説明と同じ意味である。)

【0120】本反応式(2)は一般式〔Ia〕で示されるジオキソ誘導体を金属水素化物還元剤による還元反応に付し、一般式〔Ib〕で示されるモノオキソ誘導体〔Ib〕を製造する方法である。

【0121】本反応で用いる還元剤としては通常ジソブチルアルミニウムハイドライド、ナトリウムビス(2-メトキシエトキシ)アルミニウムハイドライドあるいはリチウムアルミニウムハイドライド等の金属水素化物が好ましく用いられる。反応溶媒としては、エーテル系溶媒(ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンなど)、ベン

rnal of Organic Chemistry, vol 56, P. 6897~6904 (1991)に記載された条件に準じて設定できる。

【0116】一般式〔IIa〕のWが水素原子およびホスホリル基のいずれの場合の反応においても、〔IIa〕および〔III〕との各原料のモル比は任意に設定できるが、一般式〔IIa〕の化合物を一般式〔III〕で示される化合物に対して1~3倍モル使用すれば十分である。

【0117】一方の原料である一般式〔III〕で示されるカルボニル誘導体は、多くの場合対応するフェノール誘導体から効率良く製造でき、その製造条件としては一般的なフェノール類のエーテル製造法を広く用いて何ら差し支えない。目的物の単離精製法は再結晶、シリカゲルを用いた各種のクロマトグラフィー、蒸留等の有機合成上自公知の手法を用いて容易に目的を達成しうる。

【0118】

【化17】

ゼン系溶媒(ベンゼン、トルエン等)あるいはアルカン系溶媒(n-ペンタン、n-ヘキサン、c-ヘキサン、n-ペンタンなど)及びその混合溶媒を好適に用いることができる。

【0122】反応温度は-10℃から使用する溶媒の沸点の範囲を設定することができる。

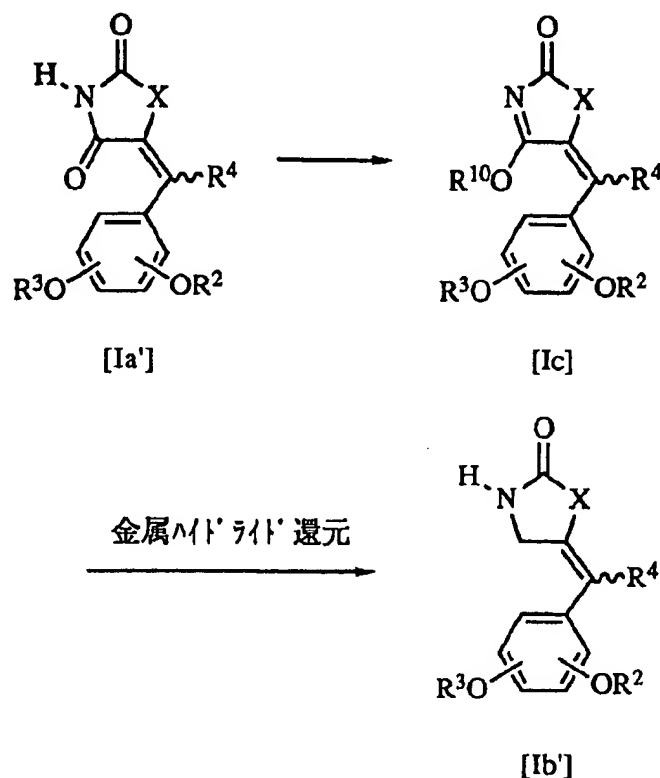
【0123】使用する金属水素還元剤の量については、活性ハイドライドとして2分子換算量が反応に消費されるが、通常この2~10倍程度量を用いれば反応は比較的速やかに完結する。目的物の単離精製法は反応式(1)における方法のそれに準ずることができる。

【0124】

【化18】

111
反応式 (3)

112



【0125】(反応式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 および X は前述の一般式〔I〕の説明と同じ意味であり、 R^{10} は炭素数1～4の低級アルキル基を示す。)

【0126】反応式(3)は一般式〔I〕の R^1 が水素原子、 Y がカルボニル基である一般式〔Ia'〕で表わされるジオキソ誘導体を α -アルキル化イミノエーテル誘導体〔Ic〕に誘導し、これを金属ハライドにより還元し、対応するモノオキソ誘導体〔Ib'〕を製造する方法である。一般的にモノオキソ誘導体を製造する方法としては、前述の反応式(2)で説明した方法を用いることもできるが、その製法においては比較的強力な金属ハライド還元剤を用いることが多いため、 R^2 ないし R^3 にエステル基、カルボキシ基、アミド基またはアミド結合などを含む化合物あるいは X が酸素原子である化合物などを用いる場合には、それらの官能基部分も還元を受け所望の化合物を収率良く得ることが困難なこともある。本製造法はこのような場合に特に優れた代替製造法を提供するものである。すなわち、金属ハライド還元反応に付す基質をイミノエーテルに変換して使用するため、反応式(2)で通常用いる還元剤よりも緩和な金属ハライド還元剤で目的を達することができ、上述のような官能基を損なうことが少い。

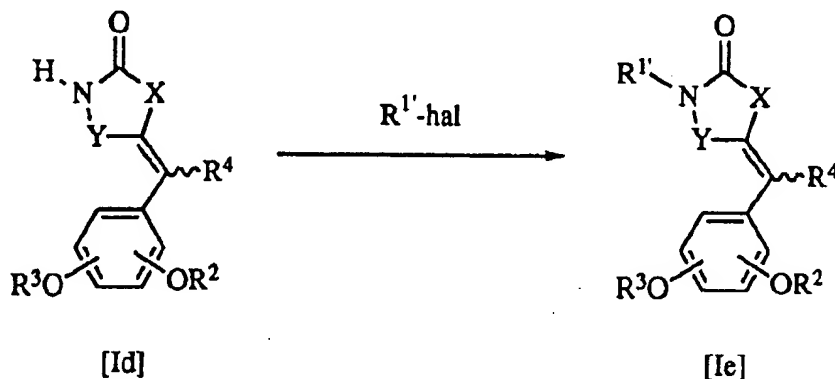
【0127】最初のアルキル化工程においては、所望の α -アルキル化に対する選択性を効率良く得るための試剤としては、通常ジアルキル硫酸(ジメチル硫酸、ジエチル硫酸など)またはトリアルキルオキシニウムテトラフルオロボレート-Meerwein試薬(トリメチルオキシニウムテトラフルオロボレート、トリエチルオキシニウムテトラフルオロボレートなど)などのアルキル化剤が好適に用いられる。

【0128】次のイミノエーテル誘導体〔Ic〕を還元するために用いられる金属ハイドライド系還元剤としては水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムなどを挙げることができ、通常反応温度も -40°C ～室温程度の温和な条件下で進行することが多い。一般式〔Ic〕及び目的物〔Ib'〕の単離精製方法は反応式(1)における方法のそれに準じて行うことができるが、〔Ic〕の中には水分に対して不安定なものがあるため、極力水との接触を避けた抽出、精製法を採用することが好結果につながるが多く、また粗生成物のまま次の還元反応に供しても通常何ら差し支えない。

【0129】

【化19】

113
反応式 (4)



【0130】(反応式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 X および Y は前述の一般式〔I〕の説明と同じ意味であり、 $R^{1'}$ は一般式〔I〕の R^1 のうち水素原子を除く各置換基を、 hal は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メタンスルホニルオキシ基または p -トルエンスルホニルオキシ基を示す。)

【0131】反応式(4)は一般式〔I〕の本発明化合物のうち、一般式〔Id〕で示される N -無置換誘導体を N -アルキル化し、一般式〔Ic〕で示される N -置換誘導体を製造する方法である。

【0132】本反応は通常炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸リチウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基、水素化ナトリウム、 n -ブチルリチウムなどの金属水素化物またはトリエチルアミン、2,6-ルチジン、4- N , N -ジメチルアミノピリジン、DBN、DBUまたはトリメチルベンジルアンモニウムハイドロキサイドなどの有機塩基の存在下行うことができる。

【0133】反応溶媒としては、無機塩基あるいは、有機塩基を用いる場合には、ケトン系溶媒(アセトン、メ

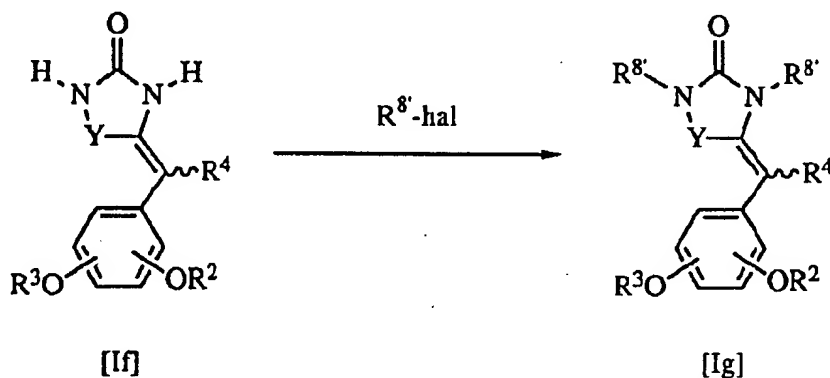
チルエチルケトン、ジエチルケトン等)、アミド系溶媒(ホルムアミド、 N , N -ジメチルホルムアミド、 N , N -ジメチルアセトアミド等)、アルコール系溶媒(メタノール、エタノール等)、水等及びこれらの混合溶媒が、金属水素化物を用いる場合には、通常、エーテル系溶媒(ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等)が好適に用いられる。

【0134】反応温度としては、無機塩基ないし有機塩基を用いる場合には、通常 0°C から溶媒の沸点までの範囲を採用することができ、金属水素化物を用いる場合には、通常 -78°C から 60°C までの範囲を採用することができる。

【0135】原料のモル比は任意に設定できるが、一般式 $R^{1'}-hal$ で表わされる反応性誘導体および塩基を一般式〔Id〕の化合物に対して1.2~3倍モル使用すれば、十分である。目的物の単離精製方法としては、反応式(1)における方法に準ずることができる。

30 【0136】
【化20】

反応式 (5)



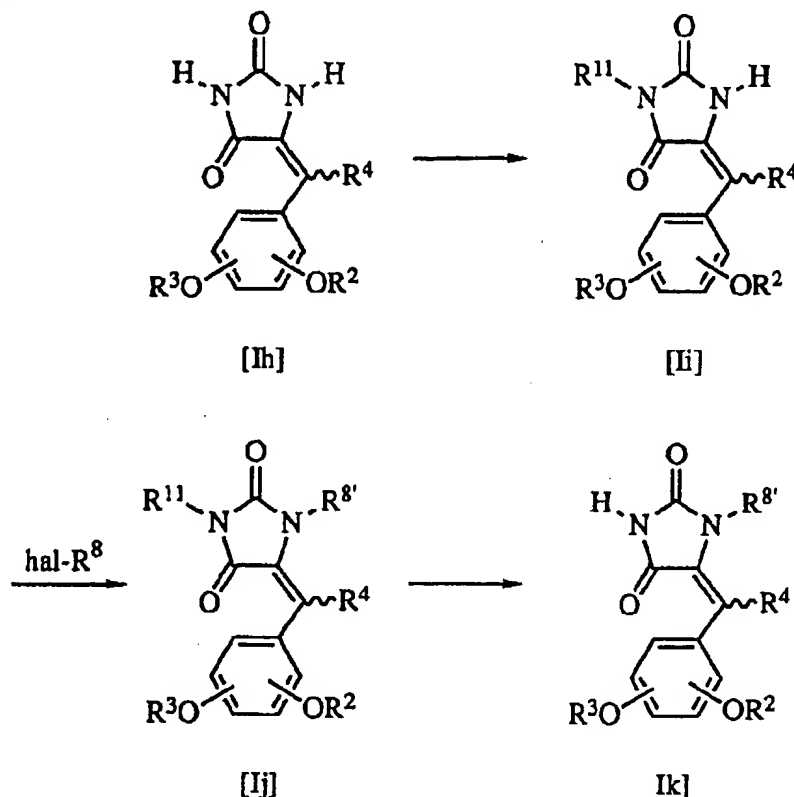
【0137】(反応式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 および Y は前述の一般式〔I〕の説明と同じ意味であり、 $R^{1'}$ は一般式〔I〕における X の中で、窒素原子上の置換基 R^1 のうち水素原子を除く各置換基を、 hal は前述の反応式(4)における説明と同じ意味である。)反応式(5)は一般式〔If〕で示される N -無置換誘導体を N -

ジアルキル化し、一般式で示される同一の置換基を有するジアルキル誘導体〔Ig〕を一挙に製造する方法である。

【0138】本法の反応条件としては、前述の反応式(4)で説明した反応条件のうち、使用するアルキル化剤および塩基量を原料のベンジリデン誘導体に対して、

反応式 (4) で設定したモル比のさらに倍量に変更する
以外、同様の反応条件を設定できる。

反応式 (6)



【0140】(反応式中、R¹、R²およびR³は前述の一般式 [I] の説明と同じ意味であり；R⁴ および hal は前述のそれぞれ反応式 (5) および (4) における説明と同じであり；R⁵ は保護基を意味する。) 本法は、一般式で表わされる 1, 3-無置換-2, 4-イミダゾリジンジオン誘導体 [Ih] の 3 位に選択的に保護基 R⁵ を導入した [Ii] を用いて、この 1 位をアルキル化し [Ij] に導いた後、3 位の保護基を除き、1 位のみがアルキル基で置換された 2, 4-ジイミダゾリジンジオン誘導体 [Ik] を製造する方法である。

【0141】一般式 [Ik] で表わされる 1-アルキル-2, 4-イミダゾリジンジオン誘導体は反応式 (1) で示す製造ルートによっても製造することができるが、反応式 (1) の一般式 [IIa] で示される原料で X が置換アルキルアミノ基で示される化合物のうち、アルキル基の末端部位が Y¹ で示されるような種々の官能基で置換されているような場合には、原料 [IIa] が効率良く製造できないものもあり、本法はそのような際にはその代替製造法として意義深い製造法となり得る。

【0142】R⁵ で示した保護基としては、2-トリメチルシリルエトキシメチル基 (Me₃SiCH₂CH₂OCH₂-、メトキシメチル基 (MeOCH₂-)、CO₂R (R は低級アルキル基を意味する。) t-ブトキシカルボニル基、p-メトキシベンジルオキシカルボニル基などが好ましく用いられ、その導入および脱保護は、それぞれの保護基の通常用いられる脱保護条件を用いることによって容易に達成され

【0139】

【化21】

る。

【0143】一般式 [Ii] で示される 1-無置換体をアルキル化する反応は、反応式 (4) と同様の反応条件を用いて行うことができる。

【0144】本発明の一般式 [I] のベンジリデン誘導体及び可能な場合は薬学的に許容し得るその塩の投与形態としては、注射剤 (皮下、静脈内、筋肉内、腹腔内注射)、軟膏剤、坐剤、エアゾール剤等による非経口投与又は錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤、シロップ剤、液剤、乳剤、懸濁液剤等による経口投与を挙げることができる。

【0145】本発明化合物を含有する上記の薬学的組成物は、全組成物の重量に対して、本発明化合物を約 0.1~99.5%、好ましくは約 0.5~95% を含有する。本発明化合物又は本発明化合物を含有する組成物に加えて、他の薬学的に活性な化合物を含ませることができる。又は、これらの組成物は本発明化合物の複数を含ませることができる。

【0146】本発明化合物の臨床的投与量は、年齢、体重、患者の感受性、症状の程度等により異なるが、通常効果的な投与量は、成人一日 0.003~1.5g 好ましくは 0.01~0.6g 程度である。しかし、必要により上記の範囲外の量を用いることもできる。本発明化合物は製薬の慣用手段によって投与用に製剤化される。

【0147】即ち、経口投与用の錠剤、カプセル剤、顆粒剤、丸剤は賦形剤、例えば白糖、乳糖、ブドウ糖、澱

粉、マンニット；結合剤、例えばシロップ、アラビアゴム、ゼラチン、ソルビット、トラガント、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン；崩壊剤、例えば澱粉、カルボキシメチルセルロース又はそのカルシウム塩、微結晶セルロース、ポリエチレングリコール；滑沢剤、例えばタルク、ステアリン酸マグネシウム又はカルシウム、シリカ；潤滑剤、例えばラウリル酸ナトリウム、グリセロール等を使用して調製される。

【0148】注射剤、液剤、乳剤、懸濁剤、シロップ剤及びエアゾール剤は、活性成分の溶剤、例えば水、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ポリエチレングリコール；界面活性剤、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、水素添加ヒマシ油のポリオキシエチレンエーテル、レシチン；懸濁剤、例えばカルボキシメチルセルロースナトリウム塩、メチルセルロース等のセルロース誘導体、トラガント、アラビアゴム等の天然ゴム類；保存剤、例えばパラオキシ安息香酸のエステル、塩化ベンザルコニウム、ソルビン酸塩等を使用して調製される。

【0149】坐剤は、例えばポリエチレングリコール、ラノリン、ココナット油等を使用して調製される。

【0150】

【実施例】

【0151】実施例（参考例、合成例、製剤例、試験例）

以下、本発明について、実施例（参考例、合成例、製剤例、試験例）を挙げて詳述するが、本発明はこれらの実施例に何ら限定されるものではない。

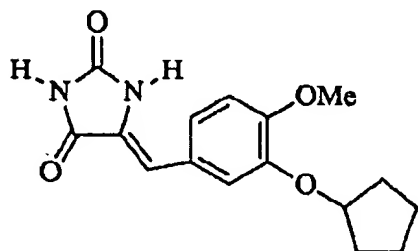
【0152】尚、参考例、合成例又は表II中の「NMR」、「MS」の各記号は、それぞれ「核磁気共鳴スペクトル」及び「質量スペクトル」を表わす。又、特別の記載がない場合は核磁気共鳴スペクトルは重水素クロロホルム中で測定している。表II中の「MS」は親ピーク又は代表的なフラグメントピークのみを記載した。

【0153】合成例1

5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(Z)-ベンジリデン]-2,4-イミダゾリジンジオン

【0154】

【化22】



【0155】ジエチル-2,4-ジオキソ-イミダゾリ 50

ジネ-5-ホスホナート1.5gをテトラヒドロフラン15mlに溶解し、3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシベンズアルデヒド1.5g、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン(DBU)1.2gを加え、60℃加熱下5時間攪拌する。減圧下、溶媒を留去し、得られる残留物をクロロホルムで抽出する。抽出液は、飽和塩化アンモニウム水溶液、水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去する。得られる粗結晶はテトラヒドロフランによる再結晶、シリカゲルクロマトグラフィー（溶出液、酢酸エチル/メタノール=9/1）により精製し、最初に得られる低極性側の溶出留分より、融点223~224℃の白色結晶の標題化合物300mgを得た。

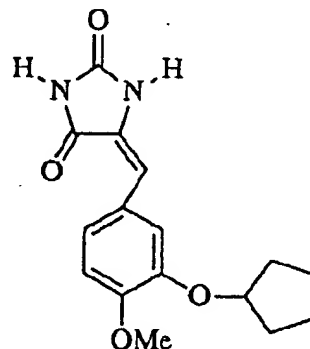
【0156】NMR δ : 7.14-6.97(3H, m), 6.6(1H, s), 4.95-4.65(1H, m), 3.9(3H, s), 2.05-1.50(8H, m). MS(m/e): 302(M⁺), 234(100%), 219, 148.

【0157】合成例2

5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(E)-ベンジリデン]-2,4-イミダゾリジンジオン

【0158】

【化23】



【0159】合成例1でのシリカゲルクロマトグラフィー（溶出液、酢酸エチル/メタノール=9/1）により続いて得られる高極性側の溶出留分から、融点258~260℃の黄色結晶の標題化合物70mgを得た。

NMR δ : 8.17(1H, s), 7.22-6.88(3H, m), 6.54(1H, s), 6.38(1H, s), 4.90-4.74(1H, m), 3.88(3H, s), 1.99-1.64(8H, m).

MS(m/e): 302(M⁺), 234(100%), 219, 148.

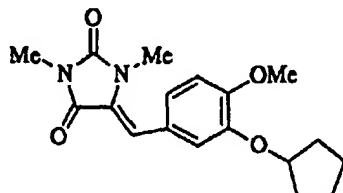
【0160】合成例3

1,3-ジメチル-5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(Z)-ベンジリデン]-2,4-イミダゾリジンジオン

【0161】

【化24】

119



【0162】5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)ベンジリデン]-2,4-イミダゾリジンジオンE, Z混合物500mgをN, N-ジメチルホルムアミド5mlに溶かし、炭酸カリウム530mgを加え90℃で2.5時間、攪拌下加熱する。減圧下、溶媒を留去し、得られる残留物をクロロホルムで抽出する。抽出液を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去する。得られる残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; 酢酸エチル/n-ヘキサン=1/3)により精製し、最初に得られる低極性側の溶出留分から、無色の油状物として、標題化合物450mgを得た。

【0163】得られた結晶は、核オーバーハウザー効果(NOE)を測定することによりその立体構造をZ体と決定した。

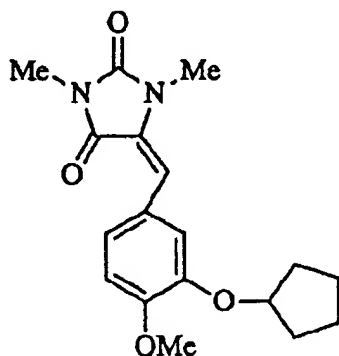
NMR δ : 6.89-6.83(4H, m), 4.78-4.77(1H, m), 3.87(3H, s), 3.12(3H, s), 3.03(3H, s), 1.94-1.62(8H, m)
MS(m/e): 330(M⁺), 262(100%), 247, 162.

【0164】合成例4

1, 3-ジメチル-5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(E)-ベンジリデン]-2, 4-イミダゾリジンジオン

【0165】

【化25】



【0166】合成例3でのシリカゲルクロマトグラフィー(溶出液; 酢酸エチル/n-ヘキサン=1/3)により続いて得られる高極性側の溶出留分から、融点118~120℃の黄色結晶として標題化合物110mgを得た。得られた結晶は、NOEを測定することにより、その立体構造をE体と決定した。

【0167】NMR δ : 8.13(1H, d), 7.26(1H, dd), 6.82(1H, d), 6.14(1H, s), 5.06-4.73(1H, m), 3.86(3H, s), 3.18(3H, s), 3.10(3H, s), 2.30-1.53(8H, m).
MS(m/e): 330(M⁺), 262(100%), 247.

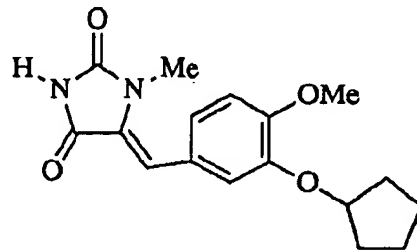
【0168】合成例5

120

1-メチル-5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(Z)-ベンジリデン]-2, 4-イミダゾリジンジオン

【0169】

【化26】



【0170】ジエチル-1-メチル-2, 4-ジオキソイミダゾリジン-5-ホスホナート20gをテトラヒドロフラン250mlに溶解し、3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシベンズアルデヒド16g, DBU13.3gを加え、60℃加熱下終夜攪拌した。減圧下、溶媒を留去し、得られる残留物をクロロホルムで抽出する。抽出液は、飽和塩化アンモニウム水溶液、水の順で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去する。得られる粗結晶は、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液; クロロホルム/メタノール=19/1)により精製し、最初に得られる低極性側の溶出留分より融点175℃~177℃の白色結晶の標題化合物3.8gを得た。

【0171】NMR δ : 9.38(1H, bs), 6.80(4H, s), 4.88-4.58(1H, m), 3.85(3H, s), 3.00(3H, s), 2.15-1.48(8H, m).

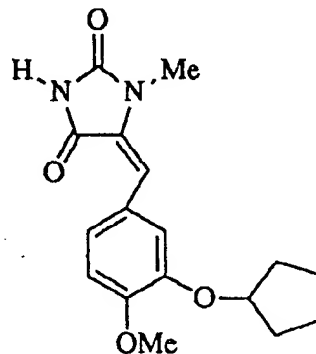
MS(m/e): 316(M⁺), 248(100%), 233, 162.

30 【0172】合成例6

1-メチル-5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ)-(E)-ベンジリデン]-2, 4-イミダゾリジンジオン

【0173】

【化27】



【0174】合成例5でのシリカゲルクロマトグラフィー(溶出液; クロロホルム/メタノール=19/1)により続いて得られる高極性側の溶出留分から、融点138℃~139℃の黄色結晶の標題化合物10.3gを得た。

50

121

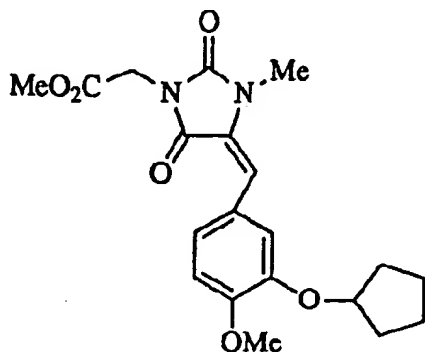
【0175】 NMR δ : 9.80(1H, bs), 8.08(1H, d), 7.15(1H, dd), 6.85(1H, d), 6.04(1H, s), 5.08-4.63(1H, m), 3.80(3H, s), 3.03(3H, s), 2.30-1.24(8H, m).
MS(m/e) : 316(M⁺), 248(100%), 233, 162.

【0176】 合成例 7

1-メチル, 3-メトキシカルボニルメチル-5-
{ (3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ) -
(E)-ベンジリデン } -2, 4-イミダゾリジンジ
オン

【0177】

【化28】



【0178】 1-メチル-5-[(3-シクロペンチル
オキシ-4-メトキシ) - (E)-ベンジリデン] -2,
4-イミダゾリジンジオン 600mg、メチルエチルケ
トン 8ml、炭酸カリウム 390mg、ブロム酢酸メチ
ルエステル 350mg の混合物を攪拌下終夜加熱還流す
る。減圧下、溶媒を留去し、得られる残留物を酢酸エチ
ルで抽出する。抽出液を飽和塩化アンモニア水、飽和食
塩水の順に洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去す
る。得られる残留物をイソプロピルエーテルから結晶化
し融点 117~119℃ の黄色結晶として標題化合物 5
40mg を得た。NMR δ : 8.07(1H, d), 7.38(1H, dd),
6.84(1H, d), 6.25(1H, s), 5.05-4.70(1H, m), 4.39
(2H, s), 3.88(3H, s), 3.76(3H, s), 3.23(3H, s), 2.
18-1.50(8H, m).

MS(m/e) : 388(M⁺), 320(100%), 305, 162.

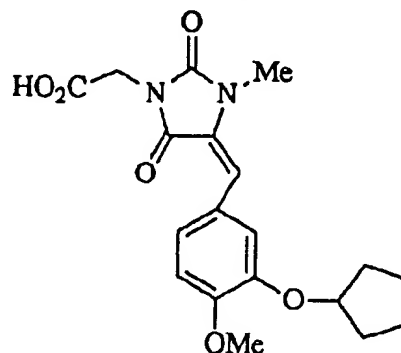
【0179】 合成例 8

1-メチル-3-カルボキシメチル-5-[(3-シク
ロペンチルオキシ-4-メトキシ) - (E)-ベンジリ
デン] -2, 4-イミダゾリジンジオン

【0180】

【化29】

122



10

【0181】 1-メチル-3-メトキシカルボニルメチ
ル-5-[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ) -
(E)-ベンジリデン] -2, 4-イミダゾリジンジ
オン 400mg をメタノール 6ml に溶解し、これに水
酸化ナトリウム 160mg をメタノール 2ml と水 2ml
の混合液にとかし、この溶液を滴下する。混合物は室
温で 4 時間攪拌する。濃塩酸により pH 7 に調整した
後、減圧下溶媒を留去し、得られる残留物に水を注ぐ。
さらに濃塩酸を用い、pH 3-4 に調整した後、得られ
た結晶を濾過、次に水で洗浄し、減圧乾燥することによ
り融点 196~199℃ の黄色結晶として標題化合物 3
50mg を得た。

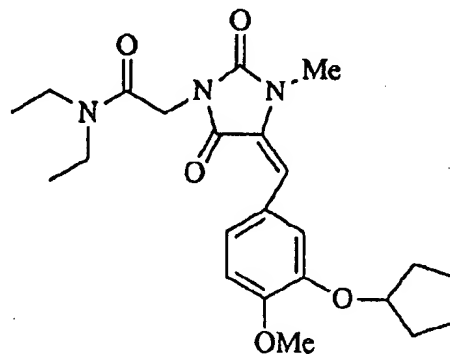
MS(m/e) : 374(M⁺), 306(100%), 291, 162.

【0182】 合成例 9

1-メチル-3-ジエチルアミノカルボニルメチル-5-
[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ) -
(E)-ベンジリデン] -2, 4-イミダゾリジンジ
オン

【0183】

【化30】



40

【0184】 1-メチル-3-カルボキシメチル-5-
[(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ) -
(E)-ベンジリデン] -2, 4-イミダゾリジンジ
オン 200mg、トリエチルアミン 70mg 及びテトラヒ
ドロフラン 6ml の混合物に氷冷下クロル炭酸イソブチ
ル 90mg を加え、同温度で 1 時間攪拌、続いてジエチ
ルアミン 120mg を加える。同温度で 1.5 時間攪拌
した後、氷浴をはずし、5 時間攪拌した。溶媒を減圧下
留去し、残留物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、
酢酸エチルで抽出する。抽出液は、さらに、飽和食塩水

50

で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去、得られる残留物をシリカゲル薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；クロロホルム／メタノール＝20／1）を用いて分離精製し、融点136℃～137℃の黄色結晶として標題化合物140mgを得た。

NMR δ : 7.90(1H, d), 7.25(1H, dd), 6.75(1H, d), 6.09(1H, s), 4.98-4.10(1H, m), 4.32(2H, s), 3.81(3H, s), 3.60-2.95(4H, m), 3.17(3H, s), 2.21-1.45(8H, m), 1.46-0.90(6H, m).

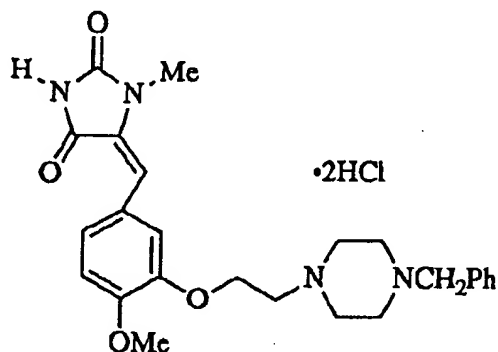
MS(m/e) : 430(M⁺), 361, 288, 261, 100(100%), 72.

【0185】合成例10

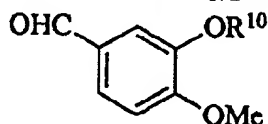
1-メチル-5-〔〔3-(4-ベンジル-1-ピペラジノエチルオキシ)-4-メトキシ〕-(E)-ベンジリデン〕-2, 4-イミダゾリジンジオン, ハイドロクロライド

【0186】

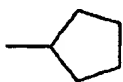
【化31】



【0187】1-メチル-5-〔〔3-(4-ベンジル-1-ピペラジノエチルオキシ)-4-メトキシ〕-(E)-ベンジリデン〕-2, 4-イミダゾリジンジオン 30



R^{10} : $-(CH_2)_3CO_2Et$, $-(CH_2)_5CO_2Et$, $-(CH_2)_2Ph$,
 $-(CH_2)_4Ph$, $-(CH_2)_3Cl$, $-(CH_2)_2Cl$,

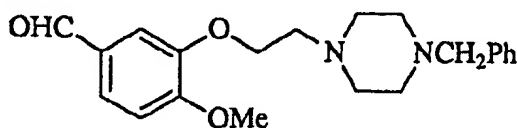


【0192】参考例2

3-(4-ベンジル-1-ピペラジノエチルオキシ)-4-メトキシベンズアルデヒド

【0193】

【化34】



ン300mgを塩化メチレン5mlにとかし、10%塩酸メタノール溶液をpHが3になるまで加え、そのまま室温で2時間攪拌する。さらにジイソプロピルエーテルを5ml加え、室温で1時間攪拌する。結晶を濾過し、塩化メチレン／ジイソプロピルエーテル＝1／1 5mlで洗浄し、融点179℃～185℃の白色結晶として標題化合物300mgを得た。

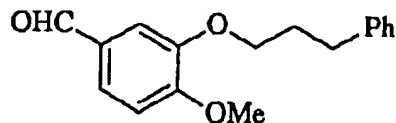
MS(m/e) : 451(M⁺-2HCl+1), 203(100%).

【0188】参考例1

3-フェニルプロポキシ-4-メトキシベンズアルデヒド

【0189】

【化32】



【0190】イソバニリン10g, 炭酸カリウム12.4g及びジメチルホルムアミド100mlの混合物に3-フェニルプロピルブロマイド11.9gを加え、攪拌下終夜加熱還流する。不溶物をろ過し、反応液を減圧下留去した後、酢酸エチルで抽出する。1N-水酸化ナトリウム水溶液、続いて飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムによって乾燥する。減圧下溶媒を留去し、無色油状物として標題化合物17.6gを得た。

NMR δ : 9.86(1H, s), 7.60-6.80(8H, m), 4.07(2H, t), 3.87(3H, s), 2.80(2H, t), 2.45-1.80(2H, m).

MS(m/e) : 270(M⁺), 152, 118(100%), 92.

同様な手法により以下の化合物も合成した。

【0191】

【化33】

【0194】3-(2-クロロエチルオキシ)-4-メトキシベンズアルデヒド6.5g、ヨウ化ナトリウム5.9gおよびジメチルホルムアミド70mlの混合物を80℃で1.5時間攪拌する。続いて炭酸カリウム6.3g、ベンジルピペラジン5.6gを加え、60℃加熱下終夜攪拌した。減圧下溶媒を留去し、残留物に炭酸カリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出する。炭酸カリウム水溶液で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、得られる残留物をシリカゲルカラムクロマ

トグラフィー (溶出液; クロロホルム/メタノール=3
9/1) により精製し、無色油状物として標題化合物
9.6 g を得た。

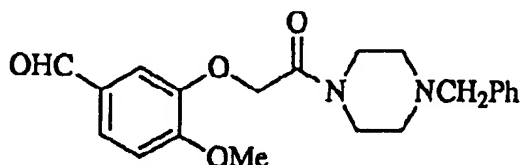
NMR δ : 9.68 (1H, s), 7.50-6.72 (8H, m), 4.10 (2H,
t), 3.80 (3H, s), 3.40 (2H, s), 2.95-2.10 (10H, m).

【0195】 参考例 3

3-(4-ベンジル-1-ピペラジノカルボニルメチル
オキシ)-4-メトキシベンズアルデヒド

【0196】

【化35】



【0197】 4-ベンジル-1-ピペラジノアセチルク
ロライド 28 g とイソパニリン 18.5 g、炭酸カリウ

ム 19.9 g およびジメチルホルムアミド 300 ml の
混合物を 60℃ 加熱下終夜攪拌する。減圧下溶媒を留去
し、得られる残留物に水を注ぎクロロホルムで抽出す
る。炭酸カリウム水溶液で洗浄、硫酸ナトリウムで乾燥
後、溶媒を留去し得られる残留物をシリカゲルカラムク
ロマトグラフィー (溶出液; 酢酸エチル/メタノール=
19/1) により精製し無色油状物として標題化合物 4
0.5 g を得た。

NMR: 9.7 (1H, s), 7.50-6.81 (8H, m), 4.72 (2H, s),
10 3.90 (3H, s), 3.70-3.30 (6H, m), 2.57-2.32 (4H, m).

MS (m/e): 368 (M⁺), 91 (100%).

【0198】 上記合成例に準じて合成した化合物を表II
に示した。化合物の構造は、表Iに示した化合物番号に
より参照される。表中の最右欄には準用した合成例の番
号を記した。

【0199】

【表80】

表 II

化合物 No.	融点 (°C)	MS (m/e)	準用した合成例 No.
1	258~261	合成例 2 参照	1
2	223~224	合成例 1 参照	1
3	118~121	合成例 4 参照	3
4	油状物	合成例 3 参照	3
5	207~211	450 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	1, 10
6	164~168	450 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	1, 10
7	214~218	464 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	5, 10
8	144~148	464 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	5, 10
9	200~203	451 (M ⁺ -HCl), 91 (100%)	1, 10
10	273~276	451 (M ⁺ -HCl), 91 (100%)	1, 10
11	185~188	436 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	1, 10
12	206~210	436 (M ⁺ -2HCl), 91 (100%)	1, 10
13	174~176	352 (M ⁺), 91 (100%)	1
14	181~184	352 (M ⁺), 91 (100%)	1
15	179~185	合成例 10 参照	5, 10
16	159~164	450 (M ⁺ -2HCl), 188 (100%)	5, 10
17	154~155	348 (M ⁺), 87 (100%)	1
18	174~177	348 (M ⁺), 87 (100%)	1
19	188~189	366 (M ⁺), 91 (100%)	1
20	200~201	366 (M ⁺), 91 (100%)	1
21	213~214	338 (M ⁺), 105 (100%)	1
22	油状物	338 (M ⁺), 105 (100%)	1
23	218~223	333 (M ⁺ -HCl), 86 (100%)	1, 10
24	250~254	334 (M ⁺ +1-HCl), 86 (100%)	1, 10
25	146~147	403 (M ⁺), 170 (100%)	1
26	59~61	403 (M ⁺), 72 (100%)	1
27	161~164	376 (M ⁺), 97 (100%)	1
28	129~132	376 (M ⁺), 97 (100%)	1
29	> 280	371 (M ⁺ +1), 115 (100%)	1, 8

127			128
30	> 280	371 (M' +1), 115 (100%)	1, 8
31	138~139	合成例 6 参照	5
32	175~177	合成例 5 参照	5
33	117~119	合成例 7 参照	7
34	61~ 63	388 (M'), 162 (100%)	7
35	油状物	430 (M'), 362 (100%),	7
36	196~199	合成例 8 参照	8
37	131~133	402 (M'), 334 (100%)	8
38	136~137	合成例 9 参照	9
39	油状物	458 (M'), 115 (100%),	9

【0200】

製剤例 1

錠 剤

化合物No. 1	10	g
乳 糖	20	g
澱 粉	4	g
澱 粉 (のり用)	1	g
ステアリン酸マグネシウム	0.1	g
カルボキシメチルセルロースカルシウム	7	g
全 量	42.1	g

上記成分を常法により混合した後、1錠中に50mgの活性成分を含有する糖衣錠とする。

【0203】

製剤例 4

軟 膏

化合物No. 1	1.0	g
オリーブ油	20	g
白色ワセリン	79	g
全 量	100	g

上記成分を常法により混合し、1%軟膏とする。

【0201】

製剤例 2

カプセル剤

化合物No. 1	10	g
乳 糖	20	g
微結晶セルロース	10	g
ステアリン酸マグネシウム	1	g
全 量	41	g

30 【0204】

上記成分を常法により混合した後、ゼラチンカプセルに充填し、1カプセル中50mgの活性成分を含有するカプセル剤とする。

【0202】

製剤例 3

軟カプセル剤

化合物No. 1	10	g
トウモロコシ油	35	g
全 量	45	g

上記成分を混合した後、常法により軟カプセル剤とする。

製剤例 5

エアゾル懸濁液

(A)

化合物No. 1	0.25	%
ミリスチン酸イソプロピル	0.10	%
エタノール	26.40	%

(B)

1,2-ジクロロテトラフルオロエタンと1-クロロペンタフルオロエタンの

60～40%の混合物

上記組成物 (A) を混合し、得られた混合液をバルブを備えた容器に仕込み、噴射剤 (B) を 20℃ で約 2.46 ～ 2.81 mg/cm² ケージ圧までバルブノズルから圧入しエアゾル懸濁剤とする。

【0205】試験方法

1) モルモット摘出気管における気管支拡張試験方法

250～450g のモルモットを放血致死させ、気管を摘出し、脂肪、結合組織を取り除いた後、幅約 2mm のらせん状に切り平滑筋組織を 4～5 個含むように 2～3 本に分割した。標本は 37℃、95% O₂ + 5% CO₂ を通気した modified-Tyrode 液を含む 8 ml のオルガン・バス中に懸垂し 1g の荷重を加えた。筋の弛緩はアイソトニックトランスジューサー (日本光電、TD-112S) を介してペンレコーダー (横河北辰電機、Type 3066) で記録した。Modified-Tyrode 液の組成は以下のとおりである (mM)。

73.25%

【0206】NaCl 137, KCl 2.7, CaCl₂ 1.8, MgCl₂ 1.0, NaHCO₃ 20, NaH₂PO₄ 0.32, Glucose 11.

標本を 60～90 分休ませた後イソプロテレノール 1 μM を加え弛緩させた。標本を洗浄し、一定の弛緩反応が得られるようになるまで 30～40 間隔でこれを繰り返した後、被験薬物を累積的に適用し弛緩させた。最後にアミノフィリン (AP) 1mM を加え最大弛緩反応を得た。弛緩反応の強さは、AP の弛緩を 100% とした場合の弛緩パーセントで表し、50% 弛緩させる濃度 (EC₅₀, μM) を求めた。薬物はジメチルスルホキシド (DMSO) に溶解し、DMSO のバス内最終濃度は 0.2% v/w とした。

【0207】試験結果

1) 気管支拡張作用

【0208】

【表 81】

表 III

供試化合物 化合物番号	EC ₅₀ (μM)	供試化合物 化合物番号	EC ₅₀ (μM)
アミノフィリン	37.0	18	7.9
1	0.33	19	3.3
2	0.94	20	1.9
3	0.28	21	0.34
4	0.22	22	0.37
5	6.3	25	0.48
6	7.6	26	1.2
7	7.0	27	2.8
8	14	28	3.4
9	1.9	31	0.21
11	0.28	32	0.12
12	2.8	33	0.44
13	0.55	34	0.46
14	3.0	35	0.54
15	3.5	37	6.9
16	2.7	38	0.35
17	3.7	39	0.42

【0209】

成人呼吸窮迫症候群等の慢性可逆閉塞性呼吸疾患の有効な予防及び治療薬として有用である。

【発明の効果】以上説明したように本発明化合物は、優れた気管支拡張作用を有し、気管支喘息、気管支炎及び

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶

277/34

401/12

403/12

409/12

識別記号

233

233

233

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

417/12

211

241

(72)発明者 鹿田 謙一

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産

化学工業株式会社生物科学研究所内